BEST AVAILABLE COPY

FUNGICIDAL TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND USE THEREOF IN CONTROLLING NOXIOUS FUNGI AND AGENT CONTAINING SAID COMPOUNDS

Patent number:

WO03004465

Publication date:

2003-01-16

Inventor:

MUELLER BERND (DE); SAUTER HUBERT (DE);

GEWEHR MARKUS (DE); GRAMMENOS WASSILIOS (DE); TORMO I BLASCO JORDI (DE); GROTE

THOMAS (DE); GYPSER ANDREAS (DE);

RHEINHEIMER JOACHIM (DE); ROSE INGO (DE); SCHAEFER PETER (DE); SCHIEWECK FRANK (DE); RACK MICHAEL (DE); LORENZ GISELA (DE); STRATHMANN SIEGFRIED (DE); AMMERMANN

EBERHARD (DE); STIERL REINHARD (DE)

Applicant:

BASF AG (DE); MUELLER BERND (DE); SAUTER

HUBERT (DE); GEWEHR MARKUS (DÉ);

GRAMMENOS WASSILIOS (DE); TORMO I BLASCO JORDI (DE); GROTE THOMAS (DE); GYPSER

ANDREAS (DE); RHEINHEIMER JOACHIM (DE); ROSE INGO (DE); SCHAEFER PETER (DE); SCHIEWECK FRANK (DE); RACK MICHAEL (DE); LORENZ GISELA (DE); STRATHMANN SIEGFRIED (DE); AMMERMANN

EBERHARD (DE); STIERL REINHARD (DE)

Classification:

- international: C07D487/04; C07D487/00; (IPC1-7): C07D; A01N;

C07C

- european: C07D487/04

Application number: WO2002EP07340 20020703 Priority number(s): DE20011032059 20010705

Also published as:

more >>

Cited documents:

EP0834513 EP1048649 WO9941255 EXP009004205

Report a data error he

Abstract of WO03004465

Triazolopyrimidines of formula (I), wherein the index and substituents have the following meaning: n = 0 or a whole number of 1 - 5; R = halogen, cyano, hydroxy, cyanate, alkyl, alkenyl, alkinyl, halogenalkyl, halogenalkenyl, alkoxy, alkenyloxy, alkinyloxy, halogenalkoxy, cycloalkyl, cycloalkenyl, cycloalkoxy, alkoxycarbonyl, alkenyloxycarbonyl, alkinyloxycarbonyl, aminocarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkoximinoalkyl, alkenyloximinocarbonyl, alkinyloximinoalkyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, alkinylcarbonyl, cycloalkylcarbonyl or a five to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S, R<1> = alkyl, alkenyl, alkinyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, phenyl, naphthyl or a five to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S, R and/or R<1> being able to be substituted according to the description; R<2> = alkyl, alkenyl or alkin which can be substituted by halogen, cyano, nitro, alkoxy or alkoxycarbonyl. The invention also relates to a method for the production of said compounds, agents containing same, and the use thereof in controlling noxious fungi.

Data supplied from the esp@cenet database - Worldwide

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum 16. Januar 2003 (16.01.2003)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer WO 03/004465 A2

(51) Internationale Patentklassifikation: A01N /, C07C /

C07D,

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP02/07340

(22) Internationales Anmeldedatum:

3. Juli 2002 (03.07.2002)

(25) Einreichungssprache:

Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache:

Deutsch

(30) Angaben zur Priorität: 101 32 059.0

5. Juli 2001 (05.07.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme von US): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; 67056 Ludwigshafen (DE).

(72) Erfinder; und (75) Erfinder/Anmelder (nur für US): MÜLLER, Bernd [DE/DE]; Jean-Ganss-Strasse 21, 67227 Frankenthal (DE). SAUTER, Hubert [DE/DE]; Neckarpromenade 20, 68167 Mannheim (DE). GEWEHR, Markus [DE/DE]: Goethestrasse 21, 56288 Kastellaun (DE). GRAM-MENOS, Wassilios [GR/DE]; Samuel-Hahnemann-Weg 9, 67071 Ludwigshafen (DE). TORMO I BLASCO, Jordi [ES/DE]; Mühlweg 47, 67117 Limburgerhof (DE). GROTE, Thomas [DE/DE]; Im Hoehnhausen 18, 67157 Wachenheim (DE). GYPSER, Andreas [DE/DE]; B 4,4, 68159 Mannheim (DE). RHEINHEIMER, Joachim [DE/DE]; Merziger Strasse 24, 67063 Ludwigshafen (DE). ROSE, Ingo [DE/DE]; C 2, 19, 68159 Mannheim (DE). SCHÄFER, Peter [DE/DE]; Römerstrasse 1, 67308 Ottersheim (DE). SCHIEWECK, Frank [DE/DE]; Lindenweg 4, 67258 Hessheim (DE). RACK,

[Fortsetzung auf der nächsten Seite]

(54) Title: FUNGICIDAL TRIAZOLOPYRIMIDINES, METHOD FOR THE PRODUCTION THEREOF AND USE THEREOF IN CONTROLLING NOXIOUS FUNGI AND AGENTS CONTAINING SAID COMPOUNDS

(54) Bezeichnung: FUNGIZIDE TRIAZOLOPYRIMIDINE, VERFAHREN ZU IHRER HERSTELLUNG UND IHRE VERWEN-DUNG ZUR BEKÄMPFUNG VON SCHADPILZEN SOWIE SIE ENTHALTENDE MITTEL

$$\begin{array}{c|c}
R^1 & & \\
R_n & & \\
R^2 & & \\
\end{array}$$

(57) Abstract: Triazolopyrimidines of formula (I), wherein the index and substituents have the following meaning: n = 0or a whole number of 1 - 5: R = halogen, cyano, hydroxy, cyanate, alkyl, alkenyl, alkinyl, halogenalkyl, halogenalkenyl, alkoxy, alkenyloxy, alkinyloxy,

halogenalkoxy, cycloalkyl, cycloalkenyl, cycloalkoxy, alkoxycarbonyl, alkenyloxycarbonyl, alkinyloxycarbonyl, aminocarbonyl, alkylaminocarbonyl, dialkylaminocarbonyl, alkoximinoalkyl, alkenyloximinocarbonyl, alkinyloximinoalkyl, alkylcarbonyl, alkenylcarbonyl, alkinylcarbonyl, cycloalkylcarbonyl or a five to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S; R1 = alkyl, alkenyl, alkinyl, cycloalkyl, cycloalkenyl, phenyl, naphthyl or a five to ten membered saturated, partially unsaturated or aromatic heterocycle, containing one to four heteroatoms from the group O, N or S, R and/or R^1 being able to be substituted according to the description; $R^2 = alkyl$, alkenyl or alkinyl which can be substituted by halogen, cyano, nitro, alkoxy or alkoxycarbonyl. The invention also relates to a method for the production of said compounds, agents containing same, and the use thereof in controlling noxious fungi.

(57) Zusammenfassung: Triazolopyrimidine der Formel (I), in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben: n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5; R Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanat, Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Halogenalkyl, Halogenalkenyl, Alkoxy, Alkinyloxy, Halogenalkoxy, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Cycloalkoxy, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkinyloxycarbonyl, Aminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkoximinoalkyl, Alkenyloximinocarbonyl, Alkinyloximinoalkyl, Alkylcarbonyl, Alkenylcarbonyl, Alkinylcarbonyl, Cycloalkylcarbonyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S; R1 Alkyl, Alkenyl, Alkinyl, Cycloalkyl, Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S, wobei R und/oder R¹ gemäss der Beschreibung substituiert sein können; R2 Alkyl, Alkenyl oder Alkinyl, die durch Halogen, Cyano, Nitro, Alkoxy oder Alkoxycarbonyl substituiert sein können; Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.

Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, 69123 Heidelberg (DE). LORENZ, Gisela [DE/DE]; Erlenweg 13, 67434 Hambach (DE). STRATHMANN, Siegfried [DE/DE]; Donnersbergstrasse 9, 67117 Limburgerhof (DE). AMMERMANN, Eberhard [DE/DE]; Von-Gagern-Strasse 2, 64646 Heppenheim (DE). STIERL, Reinhard [DE/DE]; Ginsterstrasse 17, 67112 Mutterstadt (DE).

- (74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGE-SELLSCHAFT; 67056 Ludwigshafen (DE).
- (81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,

- SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, SK, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

Veröffentlicht:

 ohne internationalen Recherchenbericht und erneut zu veröffentlichen nach Erhalt des Berichts

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe der PCT-Gazette verwiesen.

Fungizide Triazolopyrimidine, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen sowie sie enthaltende Mittel

5

Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft Triazolopyrimidine der Formel I,

10

$$N = R_n$$

$$N = R_n$$

15 in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben:

n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5;

R Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), $C_1-C_8-Alkyl$, 20 $C_2-C_{10}-Alkenyl$, $C_2-C_{10}-Alkinyl$, $C_1-C_6-Halogenalkyl$, $C_2-C_{10}-Ha-C_{10}-Halogenalkyl$ logenalkenyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_2 - C_{10} -Alkenyloxy, C_2 - C_{10} -Alkinyloxy, C_1-C_6 -Halogenalkoxy, C_3-C_6 -Cycloalkyl, C_3-C_6 -Cycloalkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkoxy, C_1 - C_8 -Alkoxycarbonyl, C_2 - C_{10} -Alkenyloxycarbonyl, $C_2-C_{10}-Alkinyloxycarbonyl$, Aminocarbonyl, 25 $C_1-C_8-Alkylaminocarbonyl$, $Di-(C_1-C_8-)$ alkylaminocarbonyl, $C_1-C_8-Alkoximinoalkyl$, $C_2-C_{10}-Alkenyloximinocarbonyl$, C_2-C_{10} -Alkinyloximinoalkyl, C_1-C_8 -Alkylcarbonyl, C_2-C_{10} -Alke $nylcarbonyl, \ C_2-C_{10}-Alkinylcarbonyl, \ C_3-C_6-Cycloalkylcarbonyl,$ oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell unge-30 sättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S;

R¹ C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkinyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei R und/oder R¹ partiell oder vollständig halogeniert oder 40 durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a substituiert sein können:

Ra Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Al-koxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, Di-C₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloal-

2

5

10

15

20

30

35

45

kyl, C_1 - C_8 -Alkoximino, C_2 - C_{10} -Alkenyloximino, C_2 - C_{10} -Alkinyloximino, Aryl- C_1 - C_8 -alkyloximino, C_2 - C_{10} -Alkinyloxycarbonyl, C_2 - C_{10} -Alkinyloxycarbonyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen Rb tragen können:

- Rb Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfoxyl, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;
- und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C1-C6-alkoxy, Aryl-C1-C6-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können; und

 R^2 $C_1-C_4-Alkyl$, $C_2-C_4-Alkenyl$ oder $C_2-C_4-Alkinyl$, die durch Halogen, Cyano, Nitro, $C_1-C_2-Alkoxy$ oder $C_1-C_4-Alkoxycarbonyl$ substituiert sein können.

Außerdem betrifft die Erfindung Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, sie enthaltende Mittel sowie ihre Verwendung zur Bekämpfung von Schadpilzen.

Aus EP-A 71 792, EP-A 550 113, WO-A 94/20501, EP-A 834 513, WO-A 98/46608 und WO-A 99/41255 sind 5-Chlortriazolopyrimidine zur Bekämpfung von Schadpilzen bekannt.

5 Ihre Wirkung ist jedoch in vielen Fällen nicht zufriedenstellend. Daher lag als Aufgabe zugrunde, Verbindungen mit verbesserter Wirksamkeit zu finden.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Verbindungen gefunden.

10 Desweiteren wurden Verfahren zu ihrer Herstellung, sie enthaltende Mittel sowie Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen unter Verwendung der Verbindungen I gefunden.

Die Verbindungen der Formel I unterscheiden sich von den aus den 15 oben genannten Schriften in der Kombination des 5-Alkylrestes mit über Kohlenstoff gebundenen Gruppen in der 7-Position.

Die Verbindungen der Formel I weisen eine gegenüber den bekannten Verbindungen erhöhte Wirksamkeit gegen Schadpilze auf.

20

Die Verbindungen I können auf verschiedenen Wegen erhalten werden; vorteilhaft geht man von 5-Aminotriazol der Formel II aus, das mit Dicarbonylverbindungen der Formel III kondensiert wird.

Diese Umsetzung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 80°C 30 bis 250°C, vorzugsweise 120°C bis 180°C, ohne Solvens oder in einem inerten organischen Lösungsmittel in Gegenwart einer Base [vgl. EP-A 770 615] oder in Gegenwart von Essigsäure unter den aus Adv. Het. Chem. Bd. 57, S. 81ff. (1993) bekannten Bedingungen.

35

Geeignete Lösungsmittel sind aliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe, Ether, Nitrile, Ketone, Alkohole, sowie N-Methylpyrrolidon, Dimethylsulfoxid, Dimethylforma40 mid und Dimethylacetamid. Besonders bevorzugt wird die Umsetzung ohne Lösungsmittel oder in Chlorbenzol, Xylol, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon durchgeführt. Es können auch Gemische der ge-

45 Als Basen kommen allgemein anorganische Verbindungen wie Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydroxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkalimetalloxide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallhydride, Alkali-

nannten Lösungsmittel verwendet werden.

metallamide, Alkalimetall- und Erdalkalimetallcarbonate sowie Alkalimetallhydrogencarbonate, metallorganische Verbindungen, insbesondere Alkalimetallalkyle, Alkylmagnesiumhalogenide sowie Alkalimetall- und Erdalkalimetallalkoholate und Dimethoxymagnesium, außerdem organische Basen, z.B. tertiäre Amine wie Trimethylamin, Triethylamin, Tri-isopropylethylamin, Tributylamin und N-Methylpiperidin, N-Methylmorpholin, Pyridin, substituierte Pyridine wie Collidin, Lutidin und 4-Dimethylaminopyridin sowie bicyclische Amine in Betracht. Besonders bevorzugt werden tertiäre amine wie Tri-isopropylethylamin, Tributylamin, N-Methylmorpholin oder N-Methylpiperidin.

Die Basen werden im allgemeinen in katalytischen Mengen eingesetzt, sie können aber auch äquimolar, im Überschuß oder gegebe-15 nenfalls als Lösungsmittel verwendet werden.

Die Edukte werden im allgemeinen in äquimolaren Mengen miteinander umgesetzt. Es kann für die Ausbeute vorteilhaft sein, die Base und das Diketon III in einem Überschuß bezogen auf II einzu20 setzen.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I' sind auch zugänglich durch Umsetzung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV mit substituierten Malonsäureestern der Formel V, in 25 der R^X für C₁-C₄-Alkyl, Allyl, Phenyl oder Benzyl steht, anschließender Verseifung des entstandenen Esters VI und Decarboxylierung der Carbonsäure VIa.

40 In Formel IV steht X für Halogen, insbesondere für Chlor oder Brom. Die Verbindungen IV sind aus den eingangs zitierten Schriften bekannt. In Formel I' haben n, R und R^1 die für Formel I definierte Bedeutung und R^A steht für Wasserstoff oder C_1 - C_3 -Alkyl, das durch Halogen, Cyano, Nitro oder C_1 - C_2 -Alkoxy substituiert 45 sein kann.

In einer bevorzugten Ausführungsform des erfindungsgemäßen Verfahrens bedeutet RA Wasserstoff oder Methyl, insbesondere Wasserstoff.

- 5 Die Ausgangsstoffe V sind in der Literatur bekannt [J. Am. Chem. Soc., Bd. 64, 2714 (1942); J. Org. Chem., Bd. 39, 2172 (1974); Helv. Chim. Acta, Bd. 61, 1565 (1978)] oder können gemäß der zitierten Literatur hergestellt werden.
- 10 Die anschließende Spaltung des Esters erfolgt unter den allgemein üblichen Bedingungen [vgl.: Greene & Wuts, Protective Groups in Organic Synthesis, Wiley (1991), S. 224 ff: Spaltung von Alkylestern unter Pd-Katalyse (S. 248); hydrierende Spaltung von Benzylestern (S. 251); Spaltung von Methyl- bzw. Ethylestern in Ge-
- 15 genwart von Lithiumsalzen, wie LiI (S.232), LiBr oder LiCl; oder unter sauren oder alkalischen Bedingungen]. In Abhängigkeit der Strukturelemente RA, Rn und R1 kann die alkalische oder die saure Verseifung der Verbindungen VI vorteilhaft sein. Unter den Bedingungen der Esterverseifung kann die Decarboxylierung zu I' be-
- 20 reits ganz oder teilweise erfolgen.

Die Decarboxylierung erfolgt üblicherweise bei Temperaturen von 20°C bis 180°C, vorzugsweise 50°C bis 120°C, in einem inerten Lösungsmittel, gegebenenfalls in Gegenwart einer Säure.

25

Geeignete Säuren sind Salzsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, p-Toluolsulfonsäure. Geeignete Lösungsmittel sind Wasser, aliphatische Kohlenwasserstoffe wie Pentan, Hexan, Cyclohexan und Petrolether, aromatische Kohlenwasserstoffe

- 30 wie Toluol, o-, m- und p-Xylol, halogenierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid, Chloroform und Chlorbenzol, Ether wie Diethylether, Diisopropylether, tert.-Butylmethylether, Dioxan, Anisol und Tetrahydrofuran, Nitrile wie Acetonitril und Propionitril, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Diethylketon und
- 35 tert.-Butylmethylketon, Alkohole wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol, n-Butanol und tert.-Butanol, sowie Dimethylsulfoxid, Dimethylformamid und Dimethylacetamid, besonders bevorzugt wird die Reaktion in Salzsäure oder Essigsäure durchgeführt. Es können auch Gemische der genannten Lösungsmittel verwendet wer-

40 den.

Verbindungen der Formel I können auch durch Kupplung von 5-Halogentriazolopyrimidinen der Formel IV mit metallorganischen Reagenzien der Formel VII erhalten werden. In einer Ausführungsform 45 dieses Verfahrens erfolgt die Umsetzung unter Übergangsmetallkatalyse, wie Ni- oder Pd-Katalyse.

6

5

In Formel VII steht M für ein Metallion der Wertigkeit Y, wie beispielsweise B, Zn oder Sn. Diese Reaktion kann beispielsweise analog folgender Methoden durchgeführt werden: J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1, 1187 (1994), ebenda 1, 2345 (1996); WO-A 99/41255; 10 Aust. J. Chem., Bd. 43, 733 (1990); J. Org. Chem., Bd. 43, 358 (1978); J. Chem. Soc. Chem. Commun. 866 (1979); Tetrahedron Lett., Bd. 34, 8267 (1993); ebenda, Bd. 33, 413 (1992).

Die Reaktionsgemische werden in üblicher Weise aufgearbeitet,
15 z.B. durch Mischen mit Wasser, Trennung der Phasen und gegebenenfalls chromatographische Reinigung der Rohprodukte. Die Zwischenund Endprodukte fallen z.T. in Form farbloser oder schwach bräunlicher, zäher Öle an, die unter vermindertem Druck und bei mäßig
erhöhter Temperatur von flüchtigen Anteilen befreit oder gerei20 nigt werden. Sofern die Zwischen- und Endprodukte als Feststoffe
erhalten werden, kann die Reinigung auch durch Umkristallisieren
oder Digerieren erfolgen.

Sofern einzelne Verbindungen I nicht auf den voranstehend be-25 schriebenen Wegen zugänglich sind, können sie durch Derivatisierung anderer Verbindungen I hergestellt werden.

Sofern bei der Synthese Isomerengemische anfallen, ist im allgemeinen jedoch eine Trennung nicht unbedingt erforderlich, da sich 30 die einzelnen Isomere teilweise während der Aufbereitung für die Anwendung oder bei der Anwendung (z.B. unter Licht-, Säure- oder Baseneinwirkung) ineinander umwandeln können. Entsprechende Umwandlungen können auch nach der Anwendung, beispielsweise bei der Behandlung von Pflanzen in der behandelten Pflanze oder im zu bestämpfenden Schadpilz oder tierischen Schädling erfolgen.

Bei den in den vorstehenden Formeln angegebenen Definitionen der Symbole wurden Sammelbegriffe verwendet, die allgemein repräsentativ für die folgenden Substituenten stehen:

40

Halogen: Fluor, Chlor, Brom und Jod;

Alkyl: gesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 1 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen, z.B.
45 C₁-C₆-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methyl-propyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Di-methylpropyl,

7

1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethyl-5 butyl, 2-Ethylbutyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl und 1-Ethyl-2-methylpropyl;

Halogenalkyl: geradkettige oder verzweigte Alkylgruppen mit 1 bis
10 Kohlenstoffatomen (wie vorstehend genannt), wobei in diesen
10 Gruppen teilweise oder vollständig die Wasserstoffatome durch
Halogenatome wie vorstehend genannt ersetzt sein können, z.B.
C1-C2-Halogenalkyl wie Chlormethyl, Brommethyl, Dichlormethyl,
Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl,
Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl, Chlordifluormethyl,
1-Chlorethyl, 1-Bromethyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor2,2-difluorethyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl

und Pentafluorethyl;

- 20 Alkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer
 Doppelbindung in einer beliebigen Position, z.B. C2-C6-Alkenyl wie
 Ethenyl, 1-Propenyl, 2-Propenyl, 1-Methylethenyl, 1-Butenyl,
 2-Butenyl, 3-Butenyl, 1-Methyl-1-propenyl, 2-Methyl-1-propenyl,
 2-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 1-Pentenyl, 2-Pentenyl,
 3-Pentenyl, 4-Pentenyl, 1-Methyl-1-butenyl, 2-Methyl-1-butenyl,
 3-Methyl-1-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl, 2-Methyl-2-butenyl,
 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-3-butenyl, 3-Methyl-3-butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl, 1,2-Dimethyl-1-propenyl,
- 30 1,2-Dimethyl-2-propenyl, 1-Ethyl-1propenyl, 1-Ethyl-2propenyl, 1-Hexenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl, 5-Hexenyl,
 1-Methyl-1-pentenyl, 2-Methyl-1-pentenyl, 3-Methyl-1-pentenyl,
 4-Methyl-1-pentenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl,
 3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3-pentenyl,
- 35 2-Methyl-3pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-1-butenyl, 1,2-Dimethyl-3-butenyl, 1,3-Dimethyl-1-butenyl, 1,3-Dimethyl-2-butenyl,
- 40 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl, 2,3-Dimethyl-1butenyl, 2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl, 3,3-Dimethyl-1-butenyl, 3,3-Dimethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-1-butenyl,
 1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3-butenyl, 2-Ethyl-1-butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl, 2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl,
- 45 1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl, 1-Ethyl-2-methyl-1propenyl und 1-Ethyl-2-methyl-2-propenyl;

Halogenalkenyl: ungesättigte, geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffreste mit 2 bis 10 Kohlenstoffatomen und einer Doppelbindung in einer beliebigen Position (wie vorstehend genannt), wobei in diesen Gruppen die Wasserstoffatome teilweise oder vollständig gegen Halogenatome wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor, Chlor und Brom, ersetzt sein können;

Alkinyl: geradkettige oder verzweigte Kohlenwasserstoffgruppen
mit 2 bis 4, 6, 8 oder 10 Kohlenstoffatomen und einer Dreifach10 bindung in einer beliebigen Position, z.B. C2-C6-Alkinyl wie
Ethinyl, 1-Propinyl, 2-Propinyl, 1-Butinyl, 2-Butinyl, 3-Butinyl,
1-Methyl-2-propinyl, 1-Pentinyl, 2-Pentinyl, 3-Pentinyl,
4-Pentinyl, 1-Methyl-2-butinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3butinyl, 3-Methyl-1-butinyl, 1,1-Dimethyl-2-propinyl, 1-Ethyl-215 propinyl, 1-Hexinyl, 2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl,
1-Methyl-2-pentinyl, 1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl,
2-Methyl-3-pentinyl, 2-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-1-pentinyl,
3-Methyl-4-pentinyl, 4-Methyl-1-pentinyl, 4-Methyl-2-pentinyl,
1,1-Dimethyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 3,3-Dimethyl-1-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl1-methyl-2-propinyl;

Cycloalkyl: mono- oder bicyclische, gesättigte Kohlenwasserstoff25 gruppen mit 3 bis 6, 8, 10 oder 12 Kohlenstoffringgliedern, z.B.

C3-C8-Cycloalkyl wie Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cycloheptyl und Cyclooctyl, oder C7-C12-Bicycloalkyl;

Aryl: ein ein- bis dreikerniges aromatisches Ringsystem enthal30 tend 6 bis 14 Kohlenstoffringglieder, z.B. Phenyl, Naphthyl und
Anthracenyl;

fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome 35 aus der Gruppe O, N oder S:

- 5- oder 6-gliedriges Heterocyclyl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein Sauerstoff- oder Schwefelatom oder ein oder zwei Sauerstoff- und/oder Schwefelatome, z.B. 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl,
- 3-Tetrahydrothienyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 1971, 4-Isothiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl, 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thia-
- 25 zolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Triazolidin-3-yl,

- 1,3,4-Oxadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl, 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-2-yl,
- 5 2,4-Dihydrothien-3-yl, 2-Pyrrolin-2-yl, 2-Pyrrolin-3-yl, 3-Pyrrolin-2-yl, 3-Pyrrolin-3-yl, 2-Isoxazolin-3-yl, 3-Isoxazolin-3-yl, 4-Isoxazolin-3-yl, 2-Isoxazolin-4-yl, 3-Isoxazolin-4-yl, 4-Isoxazolin-4-yl, 2-Isoxazolin-5-yl, 3-Isoxazolin-5-yl, 4-Isoxazolin-5-yl, 2-Isothiazolin-3-yl, 3-Isothiazolin-3-yl,
- 4-Isothiazolin-3-yl, 2-Isothiazolin-4-yl, 3-Isothiazolin-4-yl, 4-Isothiazolin-4-yl, 2-Isothiazolin-5-yl, 3-Isothiazolin-5-yl, 4-Isothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl, 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydro
- pyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl, 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl,
- 3,4-Dihydrooxazol-4-yl, 3,4-Dihydrooxazol-5-yl, 3,4-Dihydrooxazol-2-yl, 3,4-Dihydrooxazol-3-yl, 3,4-Dihydrooxazol-4-yl,
 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 1,3-Dioxan-5-yl,
 2-Tetrahydropyranyl, 4-Tetrahydropyranyl, 2-Tetrahydrothienyl,
 3-Hexahydropyridazinyl, 4-Hexahydropyridazinyl, 2-Hexahydropyrimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl,
- rimidinyl, 4-Hexahydropyrimidinyl, 5-Hexahydropyrimidinyl, 2-Piperazinyl, 1,3,5-Hexahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Hexahydrotriazin-3-yl;
 - 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder
- 30 Sauerstoffatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl,
- 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl, 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-5-yl,
- 40 1,2,4-Triazol-3-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,3,4-Thiadiazol-2-yl und 1,3,4-Triazol-2-yl;
 - benzokondensiertes 5-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome oder ein Stickstoffatom und ein Sauerstoff- oder Schwefelatom: 5-Ring Heteroarylgruppen, welche ne-
- 45 ben Kohlenstoffatomen ein bis vier Stickstoffatome oder ein bis drei Stickstoffatome und ein Schwefel- oder Sauerstoffatom als Ringglieder enthalten können, und in welchen zwei benachbarte

10 ·

Kohlenstoffringglieder oder ein Stickstoff- und ein benachbartes Kohlenstoffringglied durch eine Buta-1,3-dien-1,4-diylgruppe verbrückt sein können;

- 6-gliedriges Heteroaryl, enthaltend ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome: 6-Ring Heteroarylgruppen, welche neben Kohlenstoffatomen ein bis drei bzw. ein bis vier Stickstoffatome als Ringglieder enthalten können, z.B. 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Tri-
- 10 azin-2-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl;

Alkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 3 bis 5 CH₂-Gruppen, z.B. CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂, CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂ und CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂;

15 Oxyalkylen: divalente unverzweigte Ketten aus 2 bis 4 CH₂-Gruppen, wobei eine Valenz über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂CH₂CH₂CH₂ und OCH₂CH₂CH₂;

Oxyalkylenoxy: divalente unverzweigte Ketten aus 1 bis 3 20 CH₂-Gruppen, wobei beide Valenzen über ein Sauerstoffatom an das Gerüst gebunden ist, z.B. OCH₂O, OCH₂CH₂O und OCH₂CH₂CH₂O.

In dem Umfang der vorliegenden Erfindung sind die (R)- und (S)-Isomere und die Razemate von Verbindungen der Formel I einge25 schlossen, die chirale Zentren aufweisen.

Im Hinblick auf ihre bestimmungsgemäße Verwendung der Triazolopyrimidine der Formel I sind die folgenden Bedeutungen der Substituenten, und zwar jeweils für sich allein oder in Kombination, 30 besonders bevorzugt:

Verbindungen I werden bevorzugt, in denen R^1 für C_3 - C_8 -Alkyl, C_3 - C_8 -Alkenyl, C_3 - C_6 -Cycloalkyl oder C_5 - C_6 -Cycloalkenyl steht.

35

Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 für $C_1-C_6-Alkyl$ oder $C_1-C_6-Halogenalkyl$ steht.

Daneben werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^1 für 40 C_2-C_{10} -Alkenyl oder C_2-C_{10} -Alkinyl steht.

Gleichermaßen bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R¹ für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder aromatischen Heterocyclus steht.

11

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R¹ für C_3 - C_6 -Cycloalkyl steht, welches durch C_1 - C_4 -Alkyl substituiert sein kann.

- 5 Verbindungen I werden besonders bevorzugt, in denen R^a für Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoximino, C_2 - C_6 -Alkenyloximino oder C_2 - C_6 -Alkinyloximno steht.
- 10 Insbesondere werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R^b für Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl oder C_1 - C_6 -Alkoxy steht.

Besonders bevorzugt werden auch Verbindungen I, in denen R^2 C_1-C_4-15 Alkyl bedeutet, das durch Halogen substituiert sein kann.

Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen \mathbb{R}^2 für Methyl steht.

20 Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen \mathbb{R}^2 für Halogenmethyl steht.

Insbesondere werden auch Verbindungen I bevorzugt, in denen ein Substituent R in 2-Position steht und n eine ganze Zahl von 1 bis 25 4, insbesondere 1 bis 3, bedeutet.

Außerdem werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen n 2 oder 3 bedeutet und ein Substituent R in 2-Position steht.

- 30 Weiterhin werden Verbindungen I bevorzugt, in denen R für Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_1 - C_6 -Alkoxy, C_1 - C_6 -Alkoxycarbonyl, C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkoximino- C_1 - C_6 -Alkylcarbonyl, C_1 - C_6 -Alkinyloximino- C_1 - C_6 -alkyl steht.
- 35 Gleichermaßen besonders bevorzugt sind Verbindungen I, in denen R für Fluor, Chlor, Methyl, Trifluormethyl oder Methoxy steht.

Daneben werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R_n für 2-Chlor, 2-Fluor, 2,6-Difluor, 2-Methoxy, 2-Trifluormethyl,

40 2-Trifluormethyl,6-chlor, 2-Chlor,6-fluor, 2,4,6-Trifluor, 2,6-Difluor,4-methoxy oder Pentafluor steht.

Insbesondere werden Verbindungen I besonders bevorzugt, in denen R_n für 2-Chlor,6-fluor, 2,6-Difluor,4-methoxy oder 2,4,6-Trifluor 45 steht.

12

Außerdem werden Verbindungen IA besonders bevorzugt, in denen n, R und R^1 die Bedeutungen wie in Formel I haben:

5

$$R^1$$
 R_n
 R^1
 R_n
 R_n

Insbesondere sind im Hinblick auf ihre Verwendung die in den fol10 genden Tabellen zusammengestellten Verbindungen I bevorzugt. Die
in den Tabellen für einen Substituenten genannten Gruppen stellen
außerdem für sich betrachtet, unabhängig von der Kombination, in
der sie genannt sind, eine besonders bevorzugte Ausgestaltung des
betreffenden Substituenten dar.

15

Tabelle 1

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20 Tabelle 2

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 3

25 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,6-Difluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 4

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methoxy und R^1 für 30 eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 5

Verbindungen der Formel IA, in denen $R_{\rm n}$ für 2-Trifluormethyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent- 35 spricht

Tabelle 6

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Trifluormethyl,6-chlor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der 40 Tabelle A entspricht

Tabelle 7

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor, 6-fluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent- 45 spricht

13

Tabelle 8

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4,6-Trifluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5 Tabelle 9

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,6-Difluor,4-methoxy und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10 Tabelle 10

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für Pentafluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 11

 $^{\rm 15}$ Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,3-methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 12

20 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 13

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4-Dimethyl und R^1 25 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 14

Verbindungen der Formel IA, in denen $R_{\rm n}$ für 2,5-Dimethyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 15

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-ethyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

30

Tabelle 16

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-cyano und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40

Tabelle 17

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-brom und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

14

Tabelle 18

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-chlor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 19

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-fluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 20

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,5-fluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 21

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-methoxy und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 22

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-methoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 23

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Methyl,4-ethoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30

Tabelle 24

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,5-Dimethyl,4-brom und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

35

Tabelle 25

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4-Difluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

40 Tabelle 26

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-brom und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 27

45 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor, 4-chlor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 28

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-methoxy und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 29

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 30

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,5-methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15

Tabelle 31

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-methoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

20

Tabelle 32

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-ethoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

25

Tabelle 33

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor, 4-ethyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

30 Tabelle 34

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Fluor,4-cyano und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 35

35 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4,5-Trifluor und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 36

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2,4-Dichlor und R^1 für 40 eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 37

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-fluoro und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A ent-45 spricht

16

Tabelle 38

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-methoxy und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

5

Tabelle 39

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-methyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

10

Tabelle 40

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-brom und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

15 Tabelle 41

Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-ethyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 42

20 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-methoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 43

25 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-ethoxycarbonyl und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle 44

30 Verbindungen der Formel IA, in denen R_n für 2-Chlor,4-cyano und R^1 für eine Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entspricht

Tabelle A

35	Nr.	R ¹
	A-1	CH ₃
	A-2	CH ₂ CH ₃
	A-3	CH ₂ CH ₂ CH ₃
4.0	A-4	CH(CH ₃) ₂
40	A-5	CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	A-6	(±) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	A-7	(R) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
ſ	A-8	(S) CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
45	A-9 ·	(CH ₂) ₃ CH ₃
	A-10	C (CH ₃) ₃

		1/
	Nr.	R ¹
5	A-11	(CH ₂) ₄ CH ₃
	A-12	CH(CH ₂ CH ₃) ₂
	A-13	CH ₂ CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	A-14	(±) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
	A-15	(R) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
	A-16	(S) CH(CH ₃)(CH ₂) ₂ CH ₃
10	A-17	(±) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	A-18	(R) CH ₂ CH (CH ₃) CH ₂ CH ₃
	A-19	(S) CH ₂ CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	A-20	(±) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
	A-21	(R) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
15	A-22	(S) CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂
	A-23	(CH ₂) ₅ CH ₃
	A-24	(±,±) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	A-25	(±,R) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
20	A-26	(±,s) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃
	A-27	(±) CH ₂ CH (CH ₃) CF ₃
	A-28	(R) CH ₂ CH (CH ₃) CF ₃
	A-29	(S) CH ₂ CH(CH ₃)CF ₃
-25	A-30	(±) CH ₂ CH (CF ₃) CH ₂ CH ₃
	A-31	(R) CH ₂ CH (CF ₃) CH ₂ CH ₃
[A-32	(S) CH ₂ CH (CF ₃) CH ₂ CH ₃
ļ	A-33	(±,±) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
30	A-34	(±,R) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
30	A-35	(±,S) CH(CH ₃)CH(CH ₃)CF ₃
	A-36	(±,±) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
	A-37	(±,R) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
	A-38	(±,S) CH(CH ₃)CH(CF ₃)CH ₂ CH ₃
35	A-39	CF ₃
ļ	A-40	CF ₂ CF ₃
	A-41	CF ₂ CF ₂ CF ₃
1	A-42	c-C ₃ H ₅
40	A-43	(1-CH ₃)-C-C ₃ H ₄
	A-44	C-C ₅ H ₉
	A-45	C-C ₆ H ₁₁
- [A-46	(4-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀
45	A-47	$CH_2C(CH_3) = CH_2$
	A-48	CH_2CH_2C (CH_3) = CH_2
	A-49	CH ₂ -C (CH ₃) ₃

	Nr.	R ¹
5	A-50	CH ₂ -Si(CH ₃) ₃
	A-51	n-C ₆ H ₁₃
	A-52	(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂
	A-53	(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
	A-54	CH ₂ -CH (CH ₃)-n-C ₃ H ₇
	A-55	CH(CH ₃)-n-C ₄ H ₉
10	A-56	CH ₂ -CH (C ₂ H ₅) ₂
	A-57	CH(C ₂ H ₅)-n-C ₃ H ₇
	A-58	CH ₂ -c-C ₅ H ₉
	A-59	СH ₂ -СH (CH ₃) -СH (CH ₃) ₂
	A-60	CH (CH ₃) -CH ₂ CH (CH ₃) ₂
15	A-61	СH (СH ₃) -СH (СH ₃) -С ₂ H ₅
	A-62	CH (CH ₃) -C (CH ₃) ₃
	A-63	(CH ₂) ₂ -C (CH ₃) ₃
	A-64	CH ₂ -C (CH ₃) ₂ -C ₂ H ₅
20	A-65	2-CH ₃ -c-C ₅ H ₈
	A-66	3-CH ₃ -c-C ₅ H ₈
	A-67	$C(CH_3)_2-n-C_3H_7$
	A-68	(CH ₂) ₆ -CH ₃
25	A-69	(CH ₂) ₄ -CH(CH ₃) ₂
	A-70	(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃)-C ₂ H ₅
	A-71	(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃)-n-C ₃ H ₇
	A-72	CH ₂ -CH (CH ₃)-n-C ₄ H ₉
[A-73	CH(CH ₃)-n-C ₅ H ₁₁
30	A-74	(CH ₂) ₃ C (CH ₃) ₃
	A-75	(CH ₂) ₂ CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
	A-76	(CH ₂) CH (CH ₃) -CH ₂ CH (CH ₃) ₂
[A-77	$CH(CH_3)(CH_2)_2-CH(CH_3)_2$
35 [A-78	(CH ₂) ₂ C (CH ₃) ₂ C ₂ H ₅
[A-79	CH ₂ CH (CH ₃) CH (CH ₃) C ₂ H ₅
Ī	A-80	CH (CH ₃) CH ₂ CH (CH ₃) C ₂ H ₅
[A-81	$CH_2C(CH_3)_2-n-C_3H_7$
40	A-82	$CH(CH_3)CH(CH_3)-n-C_3H_7$
	A-83	$C(CH_3)_2-n-C_4H_9$
	A-84	(CH ₂) ₂ CH(C ₂ H ₅) ₂
ſ	A-85	$CH_2CH(C_2H_5)-n-C_3H_7$
45	A-86	$CH(C_2H_5)-n-C_4H_9$
±3	A-87	CH ₂ CH (CH ₃) C (CH ₃) 3
F	A-88	CH (CH ₃) CH ₂ C (CH ₃) ₃
_		

	Nr.	R ¹
	A-89	CH ₂ C (CH ₃) ₂ CH (CH ₃) ₂
5	A-90	CH ₂ CH (C ₂ H ₅) CH (CH ₃) ₂
	A-91	Сн (Сн ₃) Сн (Сн ₃) ₂
	A-92	C (CH ₃) ₂ CH ₂ CH (CH ₃) ₂
	A-93	CH(C ₂ H ₅)CH ₂ CH(CH ₃) ₂
	A-94	CH (CH ₃) C (CH ₃) ₂ C ₂ H ₅
10	A-95	СH (СH ₃) СH (С ₂ H ₅) ₂
	A-96	C (CH ₃) ₂ CH (CH ₃) C ₂ H ₅
	A-97	СH (C ₂ H ₅) СH (CH ₃) C ₂ H ₅
	A-98	$C(CH_3)(C_2H_5)-n-C_3H_7$
	A-99	CH (n-C ₃ H ₇) ₂
15	A-100	CH (n-C ₃ H ₇) CH (CH ₃) ₂
	A-101	C(CH ₃) ₂ C(CH ₃) ₃
	A-102	$C(CH_3)(C_2H_5)-CH(CH_3)_2$
	A-103	C(C ₂ H ₅) ₃
20	A-104	$(3-CH_3)-c-C_6H_{10}$
	A-105	(2-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀
	A-106	n-C ₈ H ₁₇
	A-107	CH_2C (=NO- CH_3) CH_3
25	A-108	CH_2C (= $NO-C_2H_5$) CH_3
	A-109	CH_2C (= $NO-n-C_3H_7$) CH_3
	A-110	$CH_2C (=NO-i-C_3H_7) CH_3$
	A-111	$CH(CH_3)C(=NOCH_3)CH_3$
	A-112	$CH(CH_3)C(=NOC_2H_5)CH_3$
30	A-113	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)CH_3$
	A-114	CH(CH3)C(=NO-i-C3H7)CH3
	A-115	C (=NOCH ₃) C (=NOCH ₃) CH ₃
	A-116	C (=NOCH3) C (=NOC2H5) CH3
35	A-117	$C (=NOCH_3) C (=NO-n-C_3H_7) CH_3$
	A-118	$C (=NOCH_3) C (=NO-i-C_3H_7) CH_3$
	A-119	C (=NOC2H5) C (=NOCH3) CH3
	A-120	$C (=NOC_2H_5) C (=NOC_2H_5) CH_3$
40	A-121	$C (=NOC_2H_5) C (=NO-n-C_3H_7) CH_3$
	A-122	$C (=NOC_2H_5) C (=NO-i-C_3H_7) CH_3$
	A-123	CH_2C (=NO- CH_3) C_2H_5
Ì	A-124	CH_2C (= $NO-C_2H_5$) C_2H_5
45	A-125	$CH_2C (=NO-n-C_3H_7) C_2H_5$
*3	A-126	$CH_2C (=NO-i-C_3H_7) C_2H_5$
Ī	A-127	$CH(CH_3)C(=NOCH_3)C_2H_5$
•		

		20
	Nr.	R ¹
5	A-128	CH(CH3)C(=NOC2H5)C2H5
	A-129	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
	A-130	$CH(CH_3)C(=NO-n-C_3H_7)C_2H_5$
	A-131	C(=NOCH ₃)C(=NOCH ₃)C ₂ H ₅
	A-132	C (=NOCH3) C (=NOC2H5) C2H5
	A-133	$C (=NOCH_3) C (=NO-n-C_3H_7) C_2H_5$
10	A-134	$C (=NOCH_3) C (=NO-i-C_3H_7) C_2H_5$
10	A-135	$C (=NOC_2H_5) C (=NOCH_3) C_2H_5$
	A-136	$C (=NOC_2H_5) C (=NOC_2H_5) C_2H_5$
	A-137	$C (=NOC_2H_5) C (=NO-n-C_3H_7) C_2H_5$
	A-138	$C(=NOC_2H_5)C(=NO-i-C_3H_7)C_2H_5$
15	A-139	CH=CH-CH ₂ CH ₃
	A-140	CH ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-141	CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
	A-142	C(CH ₃) ₂ CH ₂ CH ₃
20	A-143	CH=C (CH ₃) ₂
	A-144	C (=CH ₂) -CH ₂ CH ₃
	A-145	$C(CH_3) = CH - CH_3$
	A-146	CH (CH ₃) CH=CH ₂
25	A-147	CH=CH-n-C ₃ H ₇
	A-148	CH ₂ -CH=CH-C ₂ H ₅
	A-149	(CH ₂) ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-150	$(CH_2)_3$ -CH=CH ₂
20	A-151	CH=CH-CH(CH ₃) ₂
30	A-152	CH ₂ -CH=C (CH ₃) ₂
	A-153	$(CH_2)_2 - C(CH_3) = CH_2$
	A-154	CH=C (CH ₃) -C ₂ H ₅
	A-155	$CH_2-C (=CH_2)-C_2H_5$
35	A-156	$CH_2-C(CH_3)=CH-CH_3$
	A-157	CH ₂ -CH (CH ₃)-CH=CH ₂
	A-158	C (=CH2) - CH2 - CH2 - CH3
	A-159	$C(CH_3) = CH - CH_2 - CH_3$
40	A-160	CH(CH ₃)-CH=CH-CH ₃
	A-161	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH=CH ₂
	A-162	C (=CH ₂) CH (CH ₃) 2
	A-163	$C(CH_3) = C(CH_3)_2$
45	A-164	CH(CH ₃)-C(=CH ₂)-CH ₃
	A-165	C(CH ₃) ₂ -CH=CH ₂
	A-166	$C(C_2H_5) = CH - CH_3$

		41
	Nr.	R ¹
5	A-167	$CH(C_2H_5)$ - $CH=CH_2$
	A-168	CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-169	CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-170	CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-171	CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-172	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
10	A-173	CH=CH-CH ₂ -CH (CH ₃) CH ₃
	A-174	CH ₂ -CH=CH-CH (CH ₃) CH ₃
	A-175	CH ₂ -CH ₂ -CH=C (CH ₃) CH ₃
	A-176	$CH_2-CH_2-C(CH_3)=CH_2$
	A-177	CH=CH-CH (CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
15	A-178	CH ₂ -CH=C (CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-179	CH ₂ -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃
	A-180	$CH_2-CH_2-C (CH_3) = CH-CH_3$
	A-181	CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH ₂
20	A-182	CH=C(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-183	CH ₂ -C (=CH ₂)-CH ₂ -CH ₃
	A-184	$CH_2-C(CH_3)=CH-CH_2-CH_3$
	A-185	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₃
25	A-186	CH ₂ -CH (CH ₃)-CH ₂ -CH=CH ₂
	A-187	C (=CH2) - CH2 - CH2 - CH3
	A-188	C(CH3) = CH - CH2 - CH2 - CH3
	A-189	CH(CH ₃)-CH=CH-CH ₂ -CH ₃
20	A-190	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
30	A-191	$CH(CH_3)-CH_2-CH_2-CH_2$
	A-192	CH=CH-C (CH ₃) ₃
	A-193	CH=C(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
	A-194	$CH_2-C (=CH_2)-CH (CH_3)-CH_3$
35	A-195	CH2-C(CH3)=C(CH3)-CH3
	A-196	CH ₂ -CH(CH ₃)-C(=CH ₂)-CH ₃
	A-197	C (=CH ₂) -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₃
	A-198	C (CH ₃) = CH - CH (CH ₃) - CH ₃
40	A-199	CH (CH ₃) -CH=C (CH ₃) -CH ₃
	A-200	$CH(CH_3) - CH_2 - C(=CH_2) - CH_3$
	A-201	CH=C(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-202	CH ₂ -C (=CH-CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
45	A-203	CH ₂ -CH (CH=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃
1 3	A-204	C (=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-205	CH (CH=CH2) - CH2 - CH2 - CH3

	Nr.	R ¹
	A-206	C(CH2-CH3)=CH-CH2-CH3
5	A-207	CH(CH ₂ -CH ₃)-CH=CH-CH ₃
	A-208	CH(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH=CH ₂
_	A-209	CH ₂ -C (CH ₃) ₂ -CH=CH ₂
	A-210	C(=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-211	$C(CH_3) = C(CH_3) - CH_2 - CH_3$
10	A-212	CH (CH ₃) -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃
10	A-213	CH(CH ₃)-C(CH ₃)=CH-CH ₃
	A-214	CH (CH ₃) -CH (CH ₃) -CH=CH ₂
	A-215	C(CH ₃) ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-216	C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
15	A-217	C(=CH ₂)-C(CH ₃) ₃
	A-218	C(=CH-CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
	A-219	CH (CH=CH ₂) -CH (CH ₃) -CH ₃
	A-220	$C(CH_2-CH_3) = C(CH_3) - CH_3$
20	A-221	CH(CH ₂ -CH ₃)-C(=CH ₂)-CH ₃
Ì	A-222	$C(CH_3)_2-C(=CH_2)-CH_3$
	A-223	$C(CH_3)(CH=CH_2)-CH_2-CH_3$
[A-224	$C(CH_3)(CH_2CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$
25	A-225	CH (CH ₂ CH ₃) -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
	A-226	CH (CH ₂ CH ₃) -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₃
	A-227	C(CH ₃) ₂ -C(CH ₃) ₃
	A-228	C(CH ₂ -CH ₃)-C(CH ₃) ₃
20	A-229	C(CH ₃)(CH ₂ -CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
30	A-230	CH (CH ₃) ₂) -CH (CH ₃) ₂
	A-231	CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-232	CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-233	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
35	A-234	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-235	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-236	$CH_2-CH_2-CH_2-CH_2-CH=CH_2$
	A-237	CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₃
40	A-238	CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₃
	A-239	CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH(CH ₃)-CH ₃
	A-240	$CH_2-CH_2-CH=C(CH_3)-CH_3$
L	A-241	$CH_2-CH_2-CH_2-C (=CH_2)-CH_3$
45	A-242	CH=CH-CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
	A-243	CH ₂ -CH=CH-CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
L	A-244	$CH_2-CH_2-CH=C$ (CH_3) $-CH_2-CH_3$

	Nr.	R ¹
5	A-245	$CH_2-CH_2-CH_2-C (=CH_2)-CH_2-CH_3$
	A-246	$CH_2-CH_2-C(CH_3)=CH-CH_3$
	A-247	CH ₂ -CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH ₂
	A-248	CH=CH-CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-249	CH_2 - $CH=C(CH_3)$ - CH_2 - CH_2 - CH_3
	A-250	CH ₂ -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
10	A-251	$CH_2-CH_2-C (CH_3) = CH-CH_2-CH_3$
10	A-252	CH ₂ -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₃
	A-253	CH_2 - CH_2 - CH (CH_3) - CH_2 - CH = CH_2
	A-254	CH=C(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-255	$CH_2-C (=CH_2)-CH_2-CH_2-CH_3$
15	A-256	$CH_2-C(CH_3)=CH-CH_2-CH_2-CH_3$
	A-257	CH ₂ -CH(CH ₃)-CH=CH-CH ₂ -CH ₃
	A-258	CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH=CH-CH ₃
1	A-259	CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
20	A-260	$C (=CH_2) - CH_2 - CH_2 - CH_2 - CH_3$
Ì	A-261	$C(CH_3) = CH - CH_2 - CH_2 - CH_3$
İ	A-262	CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
ĺ	A-263	СH (CH ₃) -CH ₂ -CH=CH-CH ₂ -CH ₃
25	A-264	СH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃
	A-265	CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
I	A-266	CH=CH-CH ₂ -C (CH ₃) ₃
Ī	A-267	CH ₂ -CH=CH-C (CH ₃) ₃
	A-268	CH=CH-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂
30	A-269	CH ₂ -CH=C (CH ₃) -CH (CH ₃) ₂
Ī	A-270	CH ₂ -CH ₂ -C (=CH ₂) -CH (CH ₃) ₂
Ī	A-271	$CH_2-CH_2-C (CH_3)=C (CH_3)_2$
I	A-272	$CH_2-CH_2-CH(CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
35	A-273	CH=C(CH ₃)-CH ₂ -CH(CH ₃) ₂
	A-274	$CH_2-C (=CH_2) - CH_2-CH (CH_3)_2$
Ī	A-275	$CH_2-C(CH_3)=CH-CH(CH_3)_2$
[A-276	CH_2 - CH (CH_3)- CH = C (CH_3) ₂
40 [A-277	$CH_2-CH(CH_3)-CH_2-C(=CH_2)-CH_3$
	A-278	$C (=CH_2) - CH_2 - CH_2 - CH (CH_3)_2$
	A-279	$C(CH_3) = CH - CH_2 - CH(CH_3)_2$
	A-280	CH (CH ₃) -CH=CH-CH (CH ₃) $_2$
45	A-281	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=C (CH ₃) ₂
45	A-282	$CH(CH_3) - CH_2 - CH_2 - C(=CH_2) - CH_3$
	A-283	CH=CH-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH ₃
_		

PCT/EP02/07340

	24		
	Nr.	R ¹	
5	A-284	CH_2-CH_2-C (CH_3) $_2-CH=CH_2$	
	A-285	$CH=C(CH_3)-CH(CH_3)-CH_2-CH_3$	
	A-286	$CH_2-C (=CH_2)-CH (CH_3)-CH_2-CH_3$	
	A-287	$CH_2-C(CH_3)=C(CH_3)-CH_2-CH_3$	
	A-288	CH ₂ -CH (CH ₃) -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃	
	A-289	$CH_2-CH(CH_3)-C(CH_3)=CH-CH_3$	
10	A-290	CH ₂ -CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH=CH ₂	
10	A-291	C(=CH ₂)-CH ₂ -CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	
	A-292	$C(CH_3) = CH - CH(CH_3) - CH_2 - CH_3$	
	A-293	CH (CH ₃) -CH=C (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃	
	A-294	$CH(CH_3) - CH_2 - C(=CH_2) - CH_2 - CH_3$	
15	A-295	$CH(CH_3) - CH_2 - C(CH_3) = CH - CH_3$	
	A-296	CH (CH ₃) -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH=CH ₂	
	A-297	CH ₂ -C (CH ₃) ₂ -CH=CH-CH ₃	
	A-298	CH ₂ -C (CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂	
20	A-299	$C (=CH_2) - CH (CH_3) - CH_2 - CH_2 - CH_3$	
	A-300	$C(CH_3) = C(CH_3) - CH_2 - CH_2 - CH_3$	
	A-301	CH (CH ₃) -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	
	A-302	$CH(CH_3) - C(CH_3) = CH - CH_2 - CH_3$	
25	A-303	CH (CH ₃) -CH (CH ₃) -CH=CH-CH ₃	
	A-304	CH (CH ₃) -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH=CH ₂	
	A-305	$C(CH_3)_2-CH=CH-CH_2-CH_3$	
	A-306	C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -CH=CH-CH ₃	
٦.	A-307	$C(CH_3)_2-CH_2-CH_2-CH=CH_2$	
30	A-308	CH=CH-CH(CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₃	
	A-309	$CH_2-CH=C(CH_2-CH_3)-CH_2-CH_3$	
	A-310	CH ₂ -CH ₂ -C (=CH-CH ₃) -CH ₂ -CH ₃	
	A-311	CH ₂ -CH ₂ -CH (CH=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃	
35	A-312	CH=C (CH2-CH3)-CH2-CH2-CH3	
	A-313	CH ₂ -C (=CH-CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	
l	A-314	$CH_2-CH(CH=CH_2)-CH_2-CH_3$	
	A-315	$CH_2-C(CH_2-CH_3)=CH-CH_2-CH_3$	
40	A-316	CH ₂ -CH (CH ₂ -CH ₃) -CH=CH-CH ₃	
	A-317	CH ₂ -CH(CH ₂ -CH ₃)-CH-CH=CH ₂	
	A-318	C(=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	
	A-319	CH (CH=CH ₂) -CH ₂ -CH ₂ -CH ₃	
45	A-320	$C(CH_2-CH_3)=CH-CH_2-CH_2-CH_3$	
=3	A-321	CH (CH ₂ -CH ₃) -CH=CH-CH ₂ -CH ₃	
	A-322	CH (CH ₂ -CH ₃) -CH ₂ -CH=CH-CH ₃	

		25
	Nr.	R ¹
	A-323	CH (CH ₂ -CH ₃) -CH ₂ -CH ₂ -CH=CH ₂
5	A-324	C(=CH-CH ₂ -CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-325	C(CH=CH-CH ₃)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-326	C(CH ₂ -CH=CH ₂)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-327	CH=C (CH ₃) -C (CH ₃) ₃
	A-328	CH ₂ -C (=CH ₂)-C (CH ₃) ₃
10	A-329	CH ₂ -C (CH ₃) ₂ -CH (=CH ₂) -CH ₃
10	A-330	C(=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₃
	A-331	$C(CH_3) = C(CH_3) - CH(CH_3) - CH_3$
	A-332	CH(CH ₃)-C(=CH ₂)-CH(CH ₃)-CH ₃
	A-333	$CH(CH_3) - C(CH_3) = C(CH_3) - CH_3$
15	A-334	CH (CH ₃) -CH (CH ₃) -C (=CH ₂) -CH ₃
İ	A-335	C(CH ₃) ₂ -CH=C(CH ₃)-CH ₃
	A-336	$C(CH_3)_2-CH_2-C(=CH_2)-CH_3$
	A-337	C(CH ₃) ₂ -C(=CH ₂)-CH ₂ -CH ₃
20	A-338	$C(CH_3)_2-C(CH_3)=CH-CH_3$
	A-339	C (CH ₃) ₂ -CH (CH ₃) CH=CH ₂
	A-340	CH (CH ₂ -CH ₃) -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₃
	A-341	CH (CH ₂ -CH ₃) -CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
25	A-342	$C(CH_3)(CH_2-CH_3)-CH_2-CH_2-CH_3$
	A-343	CH(i-C ₃ H ₇)-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-344	CH=C (CH ₂ -CH ₃) -CH (CH ₃) -CH ₃
	A-345	$CH_2-C (=CH-CH_3)-CH (CH_3)-CH_3$
2.0	A-346	CH_2 - CH (CH = CH_2) - CH (CH_3) - CH_3
30	A-347	$CH_2-C(CH_2-CH_3)=C(CH_3)-CH_3$
	A-348	$CH_2-CH(CH_2-CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
	A-349	$CH_2-C(CH_3)(CH=CH_2)-CH_2-CH_3$
	A-350	$C(=CH_2) - CH(CH_2 - CH_3) - CH_2 - CH_3$
35	A-351	$C(CH_3) = C(CH_2 - CH_3) - CH_2 - CH_3$
į	A-352	CH (CH ₃) -C (=CH-CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
	A-353	$CH(CH_3) - CH(CH=CH_2) - CH_2 - CH_3$
	A-354	CH=C (CH ₂ -CH ₃) -CH (CH ₃) -CH ₃
40	A-355	$CH_2-C (=CH-CH_3)-CH (CH_3)-CH_3$
	A-356	CH ₂ -CH (CH=CH ₂) -CH (CH ₃) -CH ₃
	A-357	$CH_2-C(CH_2-CH_3)=C(CH_3)-CH_3$
	A-358	$CH_2-CH(CH_2-CH_3)-C(=CH_2)-CH_3$
45	A-359	C (=CH-CH ₃) -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₃
45	A-360	CH (CH=CH ₂) -CH ₂ -CH (CH ₃) -CH ₃
	A-361	C(CH2-CH3)=CH-CH(CH3)-CH3

		26
	Nr.	R ¹
5	A-362	$CH(CH_2-CH_3)CH=C(CH_3)-CH_3$
	A-363	$CH(CH_2-CH_3)CH_2-C(=CH_2)-CH_3$
	A-364	C(=CH-CH ₃)CH(CH ₃)-CH ₂ -CH ₃
	A-365	CH (CH=CH ₂) CH (CH ₃) -CH ₂ -CH ₃
	A-366	$C(CH_2-CH_3)=C(CH_3)-CH_2-CH_3$
	A-367	CH (CH ₂ -CH ₃) -C (=CH ₂) -CH ₂ -CH ₃
10	A-368	CH (CH ₂ -CH ₃) -C (CH ₃) =CH-CH ₃
10	A-369	CH (CH ₂ -CH ₃) -CH (CH ₃) -CH=CH ₂
	A-370	$C(CH_3)(CH=CH_2)-CH_2-CH_2-CH_3$
	A-371	$C(CH_3)(CH_2-CH_3)-CH=CH-CH_3$
	A-372	C(CH3)(CH2-CH3)-CH2-CH=CH2
15	A-373	C[=C(CH ₃)-CH ₃]-CH ₂ -CH ₂ -CH ₃
	A-374	$CH[C(=CH_2)-CH_3]-CH_2-CH_2-CH_3$
	A-375	$C(i-C_3H_7) = CH-CH_2-CH_3$
	A-376	CH(i-C ₃ H ₇)-CH=CH-CH ₃
20	A-377	CH(i-C ₃ H ₇)-CH ₂ -CH=CH ₂
	A-378	C (=CH-CH ₃)-C (CH ₃) ₃
	A-379	CH (CH=CH ₂) -C (CH ₃) ₃
	A-380	C (CH ₃) (CH=CH ₂) CH (CH ₃) -CH ₃
25	A-381	$C(CH_3)(CH_2-CH_3)C(=CH_2)-CH_3$
	A-382	2-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl
	A-383	[2-(=CH ₂)]-c-C ₆ H ₉
	A-384	2-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
	A-385	2-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
30	A-386	2-CH ₃ -Cyclohex-4-enyl
	A-387	2-CH ₃ -Cyclohex-5-enyl
	A-388	2-CH ₃ -Cyclohex-6-enyl
	A-389	3-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl
35	A-390	3-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
	A-391	[3-(=CH2)]-c-C6H9
	A-392	3-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
	A-393	3-CH ₃ -Cyclohex-4-enyl
40	A-394	3-CH ₃ -Cyclohex-5-enyl
	A-395	3-CH ₃ -Cyclohex-6-enyl
	A-396	4-CH ₃ -Cyclohex-1-enyl
	A-397	4-CH ₃ -Cyclohex-2-enyl
45	A-398	4-CH ₃ -Cyclohex-3-enyl
]	A-399	$[4-(=CH_2)]-c-C_6H_9$

Die Verbindungen I eignen sich als Fungizide. Sie zeichnen sich durch eine hervorragende Wirksamkeit gegen ein breites Spektrum von pflanzenpathogenen Pilzen, insbesondere aus der Klasse der Ascomyceten, Deuteromyceten, Phycomyceten und Basidiomyceten,

5 aus. Sie sind zum Teil systemisch wirksam und können im Pflanzenschutz als Blatt- und Bodenfungizide eingesetzt werden.

Besondere Bedeutung haben sie für die Bekämpfung einer Vielzahl von Pilzen an verschiedenen Kulturpflanzen wie Weizen, Roggen,

- 10 Gerste, Hafer, Reis, Mais, Gras, Bananen, Baumwolle, Soja, Kaffee, Zuckerrohr, Wein, Obst- und Zierpflanzen und Gemüsepflanzen wie Gurken, Bohnen, Tomaten, Kartoffeln und Kürbisgewächsen, sowie an den Samen dieser Pflanzen.
- 15 Speziell eignen sie sich zur Bekämpfung folgender Pflanzenkrankheiten:
 - Alternaria-Arten an Gemüse und Obst,
 - Botrytis cinerea (Grauschimmel) an Erdbeeren, Gemüse, Zierpflanzen und Reben,
- 20 Cercospora arachidicola an Erdnüssen,
 - Erysiphe cichoracearum und Sphaerotheca fuliginea an Kürbisgewächsen,
 - Erysiphe graminis (echter Mehltau) an Getreide,
 - Fusarium- und Verticillium-Arten an verschiedenen Pflanzen,
- 25 Helminthosporium-Arten an Getreide,
 - Mycosphaerella-Arten an Bananen und Erdnüssen,
 - Phytophthora infestans an Kartoffeln und Tomaten,
 - Plasmopara viticola an Reben,
 - Podosphaera leucotricha an Apfeln,
- 30 Pseudocercosporella herpotrichoides an Weizen und Gerste,
 - Pseudoperonospora-Arten an Hopfen und Gurken,
 - Puccinia-Arten an Getreide,
 - · Pyricularia oryzae an Reis,
 - Rhizoctonia-Arten an Baumwolle, Reis und Rasen,
- 35 Septoria nodorum an Weizen,
 - Uncinula necator an Reben,
 - Ustilago-Arten an Getreide und Zuckerrohr, sowie
 - Venturia-Arten (Schorf) an Äpfeln und Birnen.
- 40 Die Verbindungen I eignen sich außerdem zur Bekämpfung von Schadpilzen wie Paecilomyces variotii im Materialschutz (z.B. Holz, Papier, Dispersionen für den Anstrich, Fasern bzw. Gewebe) und im Vorratsschutz.
- 45 Die Verbindungen I werden angewendet, indem man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Pflanzen, Saatgüter, Materialien oder den Erdboden mit einer fungizid wirksamen Menge der Wirk-

28

stoffe behandelt. Die Anwendung kann sowohl vor als auch nach der Infektion der Materialien, Pflanzen oder Samen durch die Pilze erfolgen.

5 Die fungiziden Mittel enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-% Wirkstoff.

Die Aufwandmengen liegen bei der Anwendung im Pflanzenschutz je nach Art des gewünschten Effektes zwischen 0,01 und 2,0 kg Wirk-10 stoff pro ha.

Bei der Saatgutbehandlung werden im allgemeinen Wirkstoffmengen von 0,001 bis 0,1 g, vorzugsweise 0,01 bis 0,05 g je Kilogramm Saatgut benötigt.

15

Bei der Anwendung im Material- bzw. Vorratsschutz richtet sich die Aufwandmenge an Wirkstoff nach der Art des Einsatzgebietes und des gewünschten Effekts. Übliche Aufwandmengen sind im Materialschutz beispielsweise 0,001 g bis 2 kg, vorzugsweise 20 0,005 g bis 1 kg Wirkstoff pro Qubikmeter behandelten Materials.

Die Verbindungen I können in die üblichen Formulierungen überführt werden, z.B. Lösungen, Emulsionen, Suspensionen, Stäube, Pulver, Pasten und Granulate. Die Anwendungsform richtet sich 25 nach dem jeweiligen Verwendungszweck; sie soll in jedem Fall eine feine und gleichmäßige Verteilung der erfindungsgemäßen Verbindung gewährleisten.

Die Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. 30 durch Verstrecken des Wirkstoffs mit Lösungsmitteln und/oder Trägerstoffen, gewünschtenfalls unter Verwendung von Emulgiermitteln und Dispergiermitteln, wobei im Falle von Wasser als Verdünnungsmittel auch andere organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden können. Als Hilfsstoffe kommen da-35 für im wesentlichen in Betracht: Lösungsmittel wie Aromaten (z.B. Xylol), chlorierte Aromaten (z.B. Chlorbenzole), Paraffine (z.B. Erdőlfraktionen), Alkohole (z.B. Methanol, Butanol), Ketone (z.B. Cyclohexanon), Amine (z.B. Ethanolamin, Dimethylformamid) und Wasser; Trägerstoffe wie natürliche Gesteinsmehle (z.B. Kaoline, 40 Tonerden, Talkum, Kreide) und synthetische Gesteinsmehle (z.B. hochdisperse Kieselsäure, Silikate); Emulgiermittel wie nichtionogene und anionische Emulgatoren (z.B. Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, Alkylsulfonate und Arylsulfonate) und Dispergiermittel wie Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

29

Als oberflächenaktive Stoffe kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfonsäure, Naphthalinsulfonsäure, Phenolsulfonsäure, Dibutylnaphthalinsulfonsäure, Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettalkoholsulfate und Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphtalinsulfonsäure mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxy-liertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Alkylphenolpolyglykolether, Tributylphenylpolyglykolether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether, ethoxyliertes Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoletheracetal, Sorbitester, Ligninsulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

Zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner 20 Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Benzol, Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclobexanol, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, Cyclohexanol, Cyclobexanon, Chlorbenzol, Isophogon, stark polare Lösungsmittel, z.B. Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon, Wasser, in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder ge-30 meinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe

35 hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind z.B. Mineralerden, wie Silicagel, Kieselsäuren, Silikate, Talkum, Kaolin, Attaclay, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie z.B. Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat,

40 Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver und andere feste Trägerstoffe.

30

Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 90 Gew.-% des Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Beispiele für Formulierungen sind:

5

10

45

- I. 5 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 95 Gew.-Teilen feinteiligem Kaolin innig vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 5 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- II. 30 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit einer Mischung aus 92 Gew.-Teilen pulverförmigem Kiesel-säuregel und8 Gew.-Teilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit (Wirkstoffgehalt 23 Gew.-%).
- 20 III. 10 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 90 Gew.-Teilen Xylol, 6 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 2 Gew.-Teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 2 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 9 Gew.-%).
- IV. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 60 Gew.-Teilen Cyclohexanon,
 30 Gew.-Teilen Isobutanol, 5 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und
 5Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht (Wirkstoffgehalt 16 Gew.-%).
- 35 V. 80 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-alpha-sulfonsäure, 10 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 7 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen (Wirkstoffgehalt 80 Gew.-%).
 - VI. Man vermischt 90 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung mit 10 Gew.-Teilen N-Methyl-α-pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist (Wirkstoffgehalt 90 Gew.-%).

31

VII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gew.-Teilen Cyclohexanon, 30Gew.-Teilen Isobutanol, 20 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gew.-Teilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

10

5

- VIII. 20 Gew.-Teile einer erfindungsgemäßen Verbindung werden mit 3 Gew.-Teilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 17 Gew.-Teilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gew.-Teilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gew.-Teilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 20 Die Wirkstoffe können als solche, in Form ihrer Formulierungen oder den daraus bereiteten Anwendungsformen, z.B. in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln, Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich ganz nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.
- 30 Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Pasten oder netzbaren Pulvern (Spritzpulver, Öldispersionen) durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substanzen als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-,
- 35 Dispergier- oder Emulgiermitttel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

40

Die Wirkstoffkonzentrationen in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in größeren Bereichen variiert werden. Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,0001 und 10%, vorzugsweise zwischen 0,01 und 1%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

5

Zu den Wirkstoffen können Öle verschiedenen Typs, Herbizide, Fungizide, andere Schädlingsbekämpfungsmittel, Bakterizide, gegebenenfalls auch erst unmittelbar vor der Anwendung (Tankmix), zugesetzt werden. Diese Mittel können zu den erfindungsgemäßen Mit-

10 teln im Gewichtsverhältnis 1:10 bis 10:1 zugemischt werden.

Die erfindungsgemäßen Mittel können in der Anwendungsform als Fungizide auch zusammen mit anderen Wirkstoffen vorliegen, der z.B. mit Herbiziden, Insektiziden, Wachstumsregulatoren, Fungizi15 den oder auch mit Düngemitteln. Beim Vermischen der Verbindungen I bzw. der sie enthaltenden Mittel in der Anwendungsform als Fungizide mit anderen Fungiziden erhält man in vielen Fällen eine Vergrößerung des fungiziden Wirkungsspektrums.

- 20 Die folgende Liste von Fungiziden, mit denen die erfindungsgemäßen Verbindungen gemeinsam angewendet werden können, soll die Kombinationsmöglichkeiten erläutern, nicht aber einschränken:
 - Schwefel, Dithiocarbamate und deren Derivate, wie Ferridimethyldithiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylen-
- bisdithiocarbamat, Manganethylenbisdithiocarbamat, Mangan-Zinkethylendiamin-bis-dithiocarbamat, Tetramethylthiuramdisulfide,
 Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N-ethylen-bis-dithiocarbamat), Ammoniak-Komplex von Zink-(N,N'-propylen-bis-dithiocarbamat),
 Zink-(N,N'-propylenbis-dithiocarbamat), N,N'-Polypropylen-
- 30 bis-(thiocarbamoyl)disulfid;
 - Nitroderivate, wie Dinitro-(1-methylheptyl)-phenylcrotonat,
 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-3,3-dimethylacrylat,
 2-sec-Butyl-4,6-dinitrophenyl-isopropylcarbonat,
 5-Nitro-isophthalsäure-di-isopropylester;
- heterocyclische Substanzen, wie 2-Heptadecyl-2-imidazolin-acetat, 2-Chlor-N-(4'-chlor-biphenyl-2-yl)-nicotinamid, 2,4-Dichlor-6-(o-chloranilino)-s-triazin, 0,0-Diethyl-phthalimidophosphonothioat, 5-Amino-1-[bis-(dimethylamino)-phosphinyl]-3-phenyl-1,2,4-triazol, 2,3-Dicyano-1,4-dithioanthrachi-
- non, 2-Thio-1,3-dithiolo[4,5-b]chinoxalin, 1-(Butylcarbamo-y1)-2-benzimidazol-carbaminsäuremethylester, 2-Methoxycarbonyl-amino-benzimidazol, 2-(Furyl-(2))-benzimidazol, 2-(Thiazol-y1-(4))-benzimidazol, N-(1,1,2,2-Tetrachlorethylthio)-tetra-hydrophthalimid, N-Trichlormethylthio-tetrahydrophthalimid,
- 45 N-Trichlormethylthio-phthalimid,
 - N-Dichlorfluormethylthio-N', N'-dimethyl-N-phenyl-schwefelsäure-diamid, 5-Ethoxy-3-trichlormethyl-1,2,3-thiadiazol, 2-Rhodanme-

- thylthiobenzthiazol, 1,4-Dichlor-2,5-dimethoxybenzol, 4-(2-Chlorphenylhydrazono)-3-methyl-5-isoxazolon, Pyridin-2-thio-1-oxid, 8-Hydroxychinolin bzw. dessen Kupfersalz, 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin,
- 2,3-Dihydro-5-carboxanilido-6-methyl-1,4-oxathiin-4,4-dioxid, 2-Methyl-5,6-dihydro-4H-pyran-3-carbonsäure-anilid, 2-Methyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäureanilid, 2,5-Dimethyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methyl-furan-3-carbonsäurecyclohexylamid, N-Cyclohexyl-N-methyl-furan-3-carbonsäurecyclohexyl-n-methyl-furan-3-carbonsäurecyclohexyl-n-methyl-furan-3-carbonsäurecyclohexyl-n-methyl-furan-3-carbonsäurecyclohexyl-n-methyl-furan-3-carbons
- thoxy-2,5-dimethyl-furan-3-carbonsāureamid, 2-Methyl-benzoesāu-re-anilid, 2-Iod-benzoesāure-anilid, N-Formyl-N-morpho-lin-2,2,2-trichlorethylacetal, Piperazin-1,4-diylbis-1-(2,2,2-trichlorethyl)-formamid, 1-(3,4-Dichloranilino)-1-for-mylamino-2,2,2-trichlorethan, 2,6-Dimethyl-N-tridecyl-morpholin
- bzw. dessen Salze, 2,6-Dimethyl-N-cyclododecyl-morpholin bzw.
 dessen Salze, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-cis-2,6-dimethyl-morpholin, N-[3-(p-tert.-Butylphenyl)-2-methylpropyl]-piperidin, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-ethyl-1,3-dioxolan-2-yl-ethyl]-1H-1,2,4-triazol,
- 20 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-4-n-propyl-1,3-dioxolan-2-ylethyl]-1H-1,2,4-triazol, N-(n-Propyl)-N-(2,4,6-trichlorphenoxyethyl)-N'-imidazol-yl-harnstoff, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanon, 1-(4-Chlorphenoxy)-3,3-dimethyl-1-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-2-butanol,
- 25 (2RS,3RS)-1-[3-(2-Chlorphenyl)-2-(4-fluorphenyl)-oxiran-2-ylme-thyl]-1H-1,2,4-triazol, α-(2-Chlorphenyl)-α-(4-chlorphenyl)-5-pyrimidin-methanol, 5-Butyl-2-dimethylamino-4-hydro-xy-6-methyl-pyrimidin, Bis-(p-chlorphenyl)-3-pyridinmethanol, 1,2-Bis-(3-ethoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
- 30 1,2-Bis-(3-methoxycarbonyl-2-thioureido)-benzol,
 - Strobilurine wie Methyl-E-methoxyimino- $[\alpha$ -(o-tolyloxy)-o-to-lyl]acetat, Methyl-E-2- $\{2-[6-(2-cyanophenoxy)-pyrimidin-4-yl-oxy]-phenyl\}$ -3-methoxyacrylat, Methyl-E-methoxyimino- $[\alpha$ -(2-phenoxyphenyl)]-acetamid, Methyl-E-methoxyimino- $[\alpha$ -(2,5-dime-
- thylphenoxy)-o-tolyl]-acetamid, Methyl-E-2-{2-[2-trifluorme-thylpyridyl-6-]oxymethyl]-phenyl}3-methoxyacrylat, (E,E)-Methoximino-{2-[1-(3-trifluormethylphenyl)-ethylidenaminooxyme-thyl]-phenyl}-essigsäuremethylester, Methyl-N-(2-{[1-(4-chlor-phenyl)-1H-pyrazol-3-yl]oxymethyl}phenyl)N-methoxy-carbamat,
- 40 Anilinopyrimidine wie N-(4,6-Dimethylpyrimidin-2-yl)-anilin, N-[4-Methyl-6-(1-propinyl)-pyrimidin-2-yl]-anilin, N-[4-Methyl-6-cyclopropyl-pyrimidin-2-yl]-anilin,
 - Phenylpyrrole wie 4-(2,2-Difluor-1,3-benzodioxol-4-yl)-pyrrol-3-carbonitril,
- 45 Zimtsäureamide wie 3-(4-Chlorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid, 3-(4-Fluorphenyl)-3-(3,4-dimethoxyphenyl)-acrylsäuremorpholid,

34

- sowie verschiedene Fungizide, wie Dodecylguanidinacetat,
 1-(3-Brom-6-methoxy-2-methyl-phenyl)-1-(2,3,4-trimethoxy-6-methyl-phenyl)-methanon,
 3-(3,5-Dimethyl-2-oxycyclohe-xyl)-2-hydroxyethyl]-glutarimid,
 Hexachlorbenzol,
 DL-Me-
- thyl-N-(2,6-dimethyl-phenyl)-N-furoyl(2)-alaninat,
 DL-N-(2,6-Dimethyl-phenyl)-N-(2'-methoxyacetyl)-alanin-methylester, N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-chloracetyl-D,L-2-aminobutyrolacton, DL-N-(2,6-Dimethylphenyl)-N-(phenylacetyl)-alaninmethylester, 5-Methyl-5-vinyl-3-(3,5-dichlorphenyl)-2,4-di-
- oxo-1,3-oxazolidin, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-5-methyl-5-methoxymethyl-1,3-oxazolidin-2,4-dion, 3-(3,5-Dichlorphenyl)-1-isopropylcarbamoylhydantoin, N-(3,5-Dichlorphenyl)-1,2-dimethylcyclopropan-1,2-dicarbonsäureimid, 2-Cyano-[N-(ethylaminocarbonyl)-2-methoximino]-acetamid, 1-[2-(2,4-Dichlorphenyl)-pen-
- tyl]-1H-1,2,4-triazol, 2,4-Difluor-α-(1H-1,2,4-triazolyl-1methyl)-benzhydrylalkohol, N-(3-Chlor-2,6-dinitro-4-trifluormethyl-phenyl)-5-trifluormethyl-3-chlor-2-aminopyridin,
 1-((bis-(4-Fluorphenyl)-methylsilyl)-methyl)-1H-1,2,4-triazol,
 5-Chlor-2-cyano-4-p-tolyl-imidazol-1-sulfonsäuredimethylamid,
- 3,5-Dichlor-N-(3-chlor-1-ethyl-1-methyl-2-oxo-propyl)-4-methyl-benzamid.

Synthesebeispiele

25 Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der anschließenden Tabelle mit physikalischen Angaben aufgeführt.

Beispiel 1 Herstellung von 5,7-Dimethyl-6-phenyl-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [I-1]

Eine Mischung von 0,84 g (10 mmol) 3-Aminotriazol und 1,8 g

35 (28 mmol) 3-Phenyl-pentandion-(2,4) in 5 g Tributylamin wurde
8 Std. bei 140°C bis 180°C erhitzt. Nach Abkühlen auf 20 bis 25°C
wurde der Niederschlag abfiltriert und mit Diisopropylether gewaschen. Man erhielt 0,3 g der Titelverbindung als farblose Kristalle. Das Filtrat wurde mit verd. Salzsäure extrahiert und die
40 organische Phase wurde verworfen. Nach Neutralisation wurde die
wässrige Phase mit Essigester extrahiert und eingeengt. Aus dem
Rückstand wurde nach Chromatographie an Kieselgel (Cyclohexan/Essigester-Gemische) zusätzlich 0,5 g (insgesamt 36 %) der Titelverbindung als gelbliche Kristallmasse erhalten.

35

¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,5 (s, 1H); 7,5 (m, 3H); 7,2 (m, 2H); 2,6 (s, 3H); 2,45 (s, 3H).

- Beispiel 2 Herstellung von 7-Cyclohexyl-5-methyl-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [I-4]
 - a) 7-Cyclohexyl-5-(diethylmalon-2-yl)-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin
- 10 Eine Mischung von 30 g (0,18 mol) Malonsäurediethylester in 30 ml Acetonitril wurde mit 0,3 g (12 mmol) Natriumhydrid versetzt. Anschließend gab man 2,8 g (7,6 mmol) 5-Chlor-7-cyclohexyl-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin (WO-A 99/41255) hinzu und rührte die Reaktionsmischung ca. 5 Std. bei etwa 70°C.
- 15 Dabei fielt das Natriumsalz des Produktes als gelber Festkörper aus, der abfiltriert und mit Acetonitril gewaschen wurde. Der Rückstand wurde mit etwas Kieselgur vermengt und mit einer Mischung aus verd. Salzsäure und Essigester gerührt. Die Acetonitril-Waschphase wurde ebenfalls mit verd. Salzsäure/Essigester
- 20 gerührt. Die vereinigten Essigester-Phasen wurden getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisierte und wurde mit Diisopropylether digeriert. Man erhielt 1,4 g (38 %) der Titelverbindung als farblosen Festkörper.
- 25 1 H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,55 (s, 1H); 7,5 (m, 2H); 7,2 (t, 1H); 4,6 (s, 1H); 4,0 4,4 (m, 4H); 2,3 -2,9 (m, 3H); 1,6 1,9 (m, 5H); 1,05 1,4 (m, 9H).
- b) 7-Cyclohexyl-5-methyl-6-(2-Chlor-,6-fluor-phenyl)-1,2,4-tri-30 azolo[1,5a]pyrimidin

Eine Mischung von 1,1 g (2,2 mmol) 7-Cyclohexyl-5-(diethylma-lon-2-yl)-6-(2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin (Beispiel 2a) in 10 ml konz. Salzsäure wurde 2 Stunden bei 80 bis 35 90°C gerührt. Nach Abkühlen auf 20 bis 25°C wurde mit Wasser verdünnt und die wässrige Phase mit CH₂Cl₂ extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden mit Natriumcarbonat-Lsg. gewaschen,

getrocknet und eingeengt. Der Rückstand kristallisierte und wurde mit Diisopropylether digeriert. Man erhielt 0,5 g (66 %) der Ti-

- 40 telverbindung als farblosen Festkörper vom Fp. 182 bis 184°C.
 - ¹H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,5 (s, 1H); 7,5 (m, 2H); 7,2 (t, 1H); 2,2 2,9 (m, 3H); 2,6 (s, 3H); 1,6 1,9 (m, 5H); 1,15 1,4 (m, 3H).

Beispiel 3 Herstellung von 7-Isobutyl-5-ethyl-6-(2-Cl-,6-F-phe-nyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin [I-14]

Durch eine Mischung von 1,7 g (5 mmol) 5-Cl-7-isobutyl-65 (2-Cl-,6-F-phenyl)-1,2,4-triazolo[1,5a]pyrimidin (WO-A 99/41255)
in 40 ml Tetrahydrofuran wurde ca. 15 min ein Argonstrom geleitet. Anschließend gab man 0,15 g (0,25 mmol) (1,3-Bis-(diphenyl-phosphino)-propan)-nickel-II-chlorid und 0,75 g (6 mmol) Diethylzink hinzu und rührte ca. 3 Std. bei 20 bis 25°C. Die Reaktionsmischung wurde mit Wasser verdünnt und mit CH₂Cl₂ extrahiert. Die vereinigten organischen Phasen wurden getrocknet und eingeengt. Aus dem Rückstand erhielt man nach Chromatographie an Kieselgel (RP 18) mit Cyclohexan/Essigester-Gemischen 0,2 g (12 %) der Titelverbindung als farblosen Festkörper vom Fp. 106 - 108°C.

 1 H-NMR (CDCl₃, δ in ppm): 8,5 (s, 1H); 7,5 (m, 1H); 7,45 (d, 1H); 7,2 (t, 1H); 3,05 (dd, 1H); 2,7 (m, 3H); 2,3 (m, 1H); 1,25 (t, 3H); 0,9 (d, 3H); 0,8 (d, 3H).

Н

Tabelle I: Verbindungen der Formel I

Nr.	R1	R ²	Rn	Physikalische Daten (Fp.[°C], IR[cm ⁻¹], ¹ H-NMR[ppm])
I-1	CH3	СН3	1	8,5(s,1H); 7,5(m,3H); 7,2(m,2H); 2,6(s,3H); 2,5(s,3H)
I-2	CH ₃	СН3	2-CI,6-F	117-121
I-3	(4-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀	СН3	2-Cl,6-F	190–192
I-4	c-C ₆ H ₁₁	CH3	2-C1,6-F	182–184
I-5	c-C ₅ H ₉	CH3	2-C1,6-F	179–181
9-I	CH ₂ CH (CH ₃) 2	CH3	2-C1,6-F	86-96
1-7	C-C6H11	CH3	2,4,6-F3	159–161
8-I	(CH ₂) ₃ C1	CH3	2-C1,6-F	86-96
I-9	(1-CH ₃)-c-C ₃ H ₄	CH3	2-C1,6-F	176-178
I-10	C-C ₃ H ₅	CH ₃	2-C1,6-F	8,4(s,1H); 7,5(m,2H); 7,3(t,1H); 2,4(s,3H); 2,8(m,3H), 1,1(m,2H)
I-11	(CH ₂) ₂ CH (CH ₃) ₂	CH3	2-C1,6-F	154-155
I-12	C ₆ H ₅	CH ₃	2-C1,6-F	215–217
I-13	CH (CH ₃) ₂	CH ₃	2-C1,6-F	166-168

						38						
Physikalische Daten (Fp. [°C], IR[cm-1], 1H-NMR[ppm])	106–108	99-101	1640, 1616, 1597, 1578, 1518, 101, 1440, 1275, 1200, 1191, 1151, 1137, 1122, 1042, 999	1639, 1618, 1597, 1518, 1498, 1439, 1397, 1276, 1238, 1190, 1123, 1055, 1041, 999, 848	1638, 1617, 1597, 1518, 1498, 1439, 1397, 1276, 1238, 1191, 1123, 1052, 1041, 999	8,5 (2s); 4,1, 3,9 (2s); 2,5 (s); 1,8, 1,6 (2s)	8,5 (s); 4,1, 3,95 (2s); 2,5 (2s); 1,0, 0,85 (2t)	148	142	119	59	2961, 1638, 1614, 1596, 120, 1498, 1438, 1397, 1274, 1238, 1122, 1039, 999, 843, 531
$R_{\mathbf{n}}$	2-C1,6-F	2-Cl,6-F	2,6-F ₂ ,4-OCH ₃	2,4,6-F3	2,4,6-F ₃	2,4,6-F3	2,4,6-F3	2,4,6-F ₃	2,4,6-F ₃	2,4,6-F3	2,6-F2, 4-0(CH2) ₂ CH ₃	2,4,6-F ₃
R ²	CH2CH3	СН3	СНЗ	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3
R1	CH ₂ CH (CH ₃) CH ₂ CH ₃	(S) CH ₂ CH (CH ₃) CH ₂ CH ₃	CH2-C (=NO-CH2-C ₆ H ₅) -CH ₃	CH ₂ -C (=NO-CH ₃) -CH ₃	CH ₂ -C (=NO-C ₂ H ₅) -CH ₃	CH ₂ -C (=NO-i-C ₃ H ₇) -CH ₃	CH ₂ -C (=NO-CH ₃) -C ₂ H ₅	CH ₃	CH (CH ₃) C ₂ H ₅	CH ₂ -CH (CH ₃) ₂	СН3	n−C₄H9
Nr.	1-14	I-15	I-16	I-17	I-18	I-19	1-20	I-21	1-22	I-23	I-24	I-25

.

			-	, .		_		39									
Physikalische Daten (Fp.[°C], IR[cm ⁻¹], ¹ H-NMR[ppm])	2964, 1638, 1610, 1596, 1516, 1498, 1438, 1277, 1238, 1192, 1122, 1039, 999, 843, 531	1738, 1601, 1568, 1511, 1467, 1447, 1317, 1284, 1248, 1189, 1157, 1034, 981, 895, 789	129	8,5 (s); 6,9 (m); 2,95 (m); 2,5 (s)	127	107	86	138	160	192	8,5 (s); 7,5 (m); 7,1 (m); 3,0 (m); 2,5 (s)	192	163	120	7.5	128	148
$R_{\mathbf{n}}$	2,4,6-F3	2-Cl,6-F	2,6-F2,4-CO-OCH3	2,4,6-F3	2,6-F2	2,6-F ₂	2,6-F ₂	2,6-F2	2,6-F2	2,6-F ₂	2,6-F ₂	2,6-F2	2,6-F ₂	2,4,6-F3	2,4,6-F3	2,6-F2	2,6-F ₂
R ²	СН3	CH2CO-OC2H5	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3	CH ₃	CH ₃	CH3	CH3	СНЭ	СН3	CH ₃	CH3
R1	(S) CH ₂ CH (CH ₃) C ₂ H ₅	c~C ₃ H ₅	c−C ₅ H ₉	(CH ₂) ₂ -CH (CH ₃) ₂	n-C4H9	CH ₂ CH (CH ₃) ₂	$n-C_5H_{11}$	CH (CH ₃) (CH ₂) ₂ CH ₃	CH (C ₂ H ₅) ₂	c-C ₅ H ₉	n-C ₆ H ₁₃	c-C ₆ H ₁₁	СН (СН ₃) С ₂ Н ₅	(CH ₂) ₂ CH=CH ₂	(CH ₂) ₂ CH (C1) CH ₃	n-C4H9	n-C ₆ H ₁₃
Nr.	I-26	I-27	I-28	I-29	I-30	I-31	I-32	I-33	I-34	I-35	I-36	I-37	I-38	I-39	I-40	I-41	I-42

CH3 2,6-F2 13 CH3 2,6-F2 10 CH3 2,6-F2 11 CH3 2,6-F2 13 CH3 2,6-F2 13 CH3 2,6-F2,4-OH CH3 2,4,6-F3 8,5 (s); 2,3 CH3 2,6-F2,4-OCH3 8,5 (s); 6,65 (m); 2,6-F2,4-OCH3 CH3 2,6-F2,4-OCH3 8,5 (s); 6,65 (m); 2,6-F2,4-OCH3 2,6-F2,4 CH3 2,6-F2,4-OH 2,6,65 (m); 2,6-F2,4-OH 2,6 CH3 2,6-F2,4-OH 2,6 CH3 2,6-F2,4-OH 2,6 CH3 2,6-F2,4-C4 CH3 2,6-F2	Nr.	R1	R ²	Rn	Physikalische Daten (Fp.[°C], IR[cm ⁻¹], ¹ H-NMR[ppm])
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$		CH (CH ₃) C ₂ H ₅	СН3	2,6-F ₂	135
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$		n-C ₅ H ₁₁	СН3	2,6-F ₂	102
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	10	CH(C ₂ H ₅) ₂	СН3	2,6-F2	175
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	10	CH (CH ₃) (CH ₂) ₂ CH ₃	CH ₃	2,6-F2	132
$\begin{array}{cccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	7	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2-CH3,4-F	,
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	· 6	C-C ₅ H ₉	CH ₃	2,6-F2,4-OH	299
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	0	CF3	CH3	2,4,6-F3	131
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	0	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F2,4-OCH3	185
$ \begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	त	C-C6H11	CH ₃	2,6-F2,4-OCH2CH3	(s); 6,65
$ \begin{array}{c cccccccccc} (4-CH_3)-c-C_6H_{10} & CH_3 & 2,4,6-F_3 & & 13 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-OH & & 29 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CH=CH_2 & & & 20 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CH=CH_2 & & & 20 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CM & & & 20 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CM & & & 20 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CMF_2 & & & 16 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CCHF_2 & & & 16 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CCHF_2 & & & 20 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CCHF_2 & & & 20 \\ \hline & c-C_6H_{11} & CH_3 & 2,6-F_2,4-CCHF_2 & & & 20 \\ \hline \end{array} $	2	C-C ₆ H ₁₁	CH3	2,6-F2, 4-0-n-C ₃ H ₇	108
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	3	(4-CH ₃)-c-C ₆ H ₁₀	СН3	2,4,6-F3	131
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	4	c-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F ₂ , 4-0-i-C ₃ H ₇	212
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	2	C-C6H11	СН3	2,6-F2,4-OH	290
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	9	c-C ₆ H ₁₁	СН3	2,6-F2,4-CH=CH2	207
$\begin{array}{c ccccccccccccccccccccccccccccccccccc$	-	C-C ₆ H ₁₁	CH ₃	2,6-F2,4-C ₂ H5	180
$c-C_6H_{11}$ CH_3 $2,6-F_2,4-OCHF_2$ 16 $c-C_6H_{11}$ CH_3 $2,6-F_2,$ $4-OCH_2CO_2CH_3$ $8,5$ (s); $6,65$ (m); $2,45$	8	C-C ₆ H ₁₁	CH ₃	$2, 6-F_2, 4-CN$	202
$c-C_6H_{11}$ CH_3 $2,6-F_2$, $8,5$ (s); $6,65$ (m); $4-0CH_2CO_2CH_3$ $2,45$	9	c-C ₆ H ₁₁	СН3	2,6-F2,4-OCHF2	165
	0	c-C ₆ H ₁₁	СН3	2, $6-F_2$, $4-0$ CH $_2$ CCO $_2$ CH $_3$	8,5 (s); 6,65 (m); 4,7 (s); 3,9 (s); 2,45 (s)

Nr.	R1	R2	R_{n}	Physikalische Daten (Fp.[°C], IR[cm ⁻¹], ¹ H-NMR[ppm])
I-61	c-C ₆ H ₁₁	СН3	2 , 6-F ₂ , 4-0CH ₂ CH (OCH ₃) $_2$	109
I-62	СН2СН (СН3) С2Н5	CH ₃	2-F,4-CH ₃	8,45 (s); 7,1 (m); 3,05 (m); 2,8 (m); 2,45 (s); 2,4 (s)
I-63	CH ₂ CH (CH ₃) C ₂ H ₅	СН3	4-F, 2-CH ₃	120
I-64	(CH ₂) ₂ -CH=CH ₂	CH ₃	2,4,6-F ₃	72
I-65	CH2-CH=CH2	CH ₃	2,4,6-F ₃	1639, 1611, 1598, 1518, 1496, 1439, 1280, 11213, 1201, 1123, 1036, 1000, 917, 844, 661
99-I	$CH_2-CH=CH_2$	CH_3	2,6-F2,4-OCH3	82
I-67	n-C ₅ H ₁₁	СН3	2,4,6-F3	2959, 2932, 1638, 1612, 1596, 1519, 1498, 1438, 1397, 1278, 1192, 1122, 1039, 999, 843
I-68	$^{\mathrm{n-C_6H_{13}}}$	СН3	2,4,6-F3	2957, 2931, 1638, 1610, 1597, 1519, 1498, 1438, 1397, 1277, 1239, 1192, 1122, 1039, 1000
69-I	$CH(CH_3) - (CH_2)_2CH_3$	снэ	2,4,6-F3	118
I-70	$(CH_2)_3-CH(CH_3)_2$	СН3	2,4,6-F3	8,5 (s); 6,9 (m); 2,5 (s); 0,8 (d)
I-71	$(CH_2)_2CH(CH_3)C_2H_5$	$_{ m CH_3}$	2,4,6-F ₃	8,5 (s); 6,9 (m); 2,9 (m); 2,5 (s)
I-72	СН2СН (СН3) (СН2) 2-СН3	CH3	2,4,6-F ₃	8,5 (s); 6,9 (t); 3,0 (dd); 2,8 (dd); 2,5 (s)
I-73	СН (СН ₃) −n−С ₄ Н9	$_{ m CH}_{ m 3}$	2,4,6-F3	111
I-74	$CH_2CH(C_2H_5)_2$	$_{ m CH_3}$	2,4,6-F3	06

									42						
Physikalische Daten (Fp.[°C], IR[cm-1], 1H-NMR[ppm])	110	92	125	176	103	165	81	178	145	231	2962, 1638, 1610, 1596, 1516, 1497, 1438, 1396, 1276, 1238, 1192, 1122, 1039, 999, 843	8,45 (s); 7,1 (d); 6,75 (d); 6,3 (dd); 5,05 (d); 3,45 (s); 2,4 (s)	182	170	2931, 1936, 1607, 1559, 1508, 1498, 1449, 1416, 1352, 1274, 1237, 1057, 1037, 873, 660
R _n	2,4,6-F3	2,4,6-F3	2,4,6-F3	2-F, 4-CH ₃	2,4,6-F3	2,4,6-F ₃	2,4,6-F3	2,4,6-F3	2,6-F ₂ , 4-CH=C(CH ₃) ₂	CO-NH2	2,4,6-F ₃	2,6-F ₂ , 4-CH=CH-CH(OCH ₃) ₂	2,6-F2,4-OCN	2, 6-F2, 4-COCH3	2,6-F ₂ , 4-C(=NOCH ₃)CH ₃
R ²	CH ₃	СН3	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH3	СН3	СН3	CH ₃	СН3	СН3	CH ₃	CH3	СН3
R1	CH (C ₂ H ₅) -n-C ₃ H ₇	$2-(CH_3)-c-C_3H_4$ (Diastereomer 1)	$2-(CH_3)-c-C_3H_4$ (Diastereomer 2)	c – C_6H_{11}	CH=C (CH ₃) ₂	CH (CH ₃) COCH ₃	CH2-CH=C(CH3)2	4-CH3-cylohex-3-en-1-yl	c-C ₆ H ₁₁	c – C_6H_{11}	CH ₂ CH (CH ₃) CH (CH ₃) ₂	c-C ₆ H ₁₁	c-C ₆ H ₁₁	c – C_6H_{11}	c-C ₆ H ₁₁
Nr.	I-75	9L-I	1-17	I-78	6L-I	I-80	I-81	I-82	I-83	I-84	I-85	98-I	L8-I	1-88	I-89

Nr.	R.1	, R 2	R _n	Physikalische Daten (Fp.[°C], IR[cm ⁻¹], ¹ H-NMR[ppm])
I-90	c-C ₆ H ₁₁	EHD	2 , $^6-F_2$, ^4-C (=NOC $_2$ H $_5$) CH $_3$	2932, 1607, 1557, 1509, 1497, 1453, 1443, 1417, 1351, 1279, 1049, 1036, 1003, 877, 660
I-91	C (CH ₃) =NOCH ₃	CH3	2-C1,6-F	117
I-92	C(CH3)=NO−n−C4H9	CH3	2-C1,6-F	2960, 2933, 1601, 1525, 1469, 1448, 1273, 1248, 1238, 1066, 1033, 893, 879, 785, 657
I-93	$C(CH_3) = NO - n - C_3H_7$	CH3	2-C1,6-F	100
I-94	C (CH ₃) =NOC ₂ H ₅	СН3	2-C1,6-F	94

Beispiele für die Wirkung gegen Schadpilze

Die fungizide Wirkung der Verbindungen der allgemeinen Formel I 5 ließ sich durch die folgenden Versuche zeigen:

Die Wirkstoffe wurden getrennt oder gemeinsam als 10%ige Emulsion in einem Gemisch aus 70 Gew.-% Cyclohexanon, 20 Gew.-% Nekanil® LN (Lutensol® AP6, Netzmittel mit Emulgier- und Dispergierwirkung auf der Basis ethoxylierter Alkylphenole) und 10 Gew.-% Wettol® EM (nichtionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Ricinusöl) aufbereitet und entsprechend der gewünschten Konzentration mit Wasser verdünnt.

15 Als Vergleichswirkstoffe dienten die aus WO-A 99/41255 bekannten Verbindungen A bis F:

20

ſ	Nr.	bekannt aus	R ¹
f	A	WO-A 99/41255, Nr.2c	4-CH ₃ -C-C ₆ H ₁₀
25	В	WO-A 99/41255, Nr.26	CH ₂ CH (CH ₃) ₂
İ	С	WO-A 99/41255, Nr.27	CH (CH ₃) ₂
ſ	D	WO-A 99/41255, Nr.29	C-C ₅ H ₉
ţ	E	WO-A 99/41255, Nr.30	C-C7H13
30	F	WO-A 99/41255, Nr.31	C ₆ H ₅

Anwendungsbeispiel 1 - Wirksamkeit gegen Alternaria solani an Tomaten

- 35 Blätter von Topfpflanzen der Sorte "Große Fleischtomate St. Pierre" wurden mit einer wäßrigen Suspension, die aus einer Stammlösung aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. Am folgenden Tag wurden die Blätter mit einer wäßrigen Zoosporenaufschwemmung von Alternaria solani in 2 % Biomalzlösung mit einer Dichte von 0,17 x 106 Sporen/ml infiziert. Anschließend wurden die Pflanzen in einer wasserdampfgesättigten Kammer bei Temperaturen zwischen 20 und 22°C aufgestellt. Nach 5 Tagen hatte sich die Krautfäule auf den unbehandelten, jedoch infizierten Kontroll-
- 45 pflanzen so stark entwickelt, daß der Befall visuell in % ermittelt werden konnte.

45

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-3 bis I-8, I-11 bis I-15, I-18, I-20, I-22, I-23, I-25, I-26, I-28 bis I-32, I-35 bis I-37, I-40, I-41, I-42, I-44, I-47, I-48, I-50 bis I-I-54, I-56, I-58, I-59, I-61, I-62, I-64 und I-67 bis I-74 der 5 Tabelle I behandelten Pflanzen maximal 10 % Befall, während die mit mit 63 ppm der Vergleichswirkstoffe C und D behandelten zu mindestens 80 % und die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

10 Anwendungsbeispiel 2 - Protektive Wirksamkeit gegen Gurkenmehltau

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gurkenkeimlingen der Sorte "Chinesische Schlange" wurden im Keimblattstadium mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die mit einer Stammlösung aus 10 % Wirk15 stoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht. 20 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages wurden die Pflanzen mit einer wäßrigen Sporensuspension des Gurkenmehltaus (Sphaerotheca fuliginea) inokuliert. Anschließend wurden die Pflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen 20 zwischen 20 und 24°C und 60 bis 80 % relativer Luftfeuchtigkeit für 7 Tage kultiviert. Dann wurde das Ausmaß der Mehltauentwicklung visuell in %-Befall der Keimblattfläche ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-3 bis I-9, 25 I-11 bis I-15, I-17, I-18, I-20, I-22, I-23, I-25, I-26, I-28 bis I-32, I-34, I-35, I-37, I-38, I-40, I-41, I-43, I-46, I-47, I-52, I-53, I-58, I-63, I-64, I-66 bis I-75, I-93 und I-94 der Tabelle I behandelten Pflanzen keinen oder bis maximal 10 % Befall, während die mit mit 63 ppm der Vergleichswirkstoffe A bis F behandelten zu mindestens 60 % und die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

Anwendungsbeispiel 3 - Protektive Wirksamkeit gegen die Netzflekkenkrankheit der Gerste (*Pyrenophora teres*)

Blätter von in Töpfen gewachsenen Gerstenkeimlingen der Sorte "Igri" wurden mit wäßriger Wirkstoffaufbereitung, die aus einer Stammlösung bestehend aus 10 % Wirkstoff, 63 % Cyclohexanon und 27 % Emulgiermittel angesetzt wurde, bis zur Tropfnässe besprüht und 24 Stunden nach dem Antrocknen des Spritzbelages mit einer wäßrigen Sporensuspension von Pyrenophora teres, dem Erreger der Netzfleckenkrankheit inokuliert. Anschließend wurden die Versuchspflanzen im Gewächshaus bei Temperaturen zwischen 20 und 24°C und 95 bis 100 % relativer Luftfeuchtigkeit aufgestellt. Nach 6 45 Tagen wurde das Ausmaß der Krankheitsentwicklung visuell in % Befall der gesamten Blattfläche ermittelt.

In diesem Test zeigten die mit 63 ppm der Wirkstoffe I-3 bis I-8, I-11, I-12, I-14, I-15, I-18, I-22, I-23, I-25, I-26, I-28 bis I-32, I-35, I-36, I-37, I-40 bis I-44, I-47, I-50 bis I-53, I-58, I-61 bis I-64, I-66 bis I-74 und I-77 der Tabelle I behandelten 5 Pflanzen maximal 20 % Befall, während die mit mit 63 ppm der Vergleichswirkstoffe B, D und F behandelten zu mindestens 60 % und die unbehandelten Pflanzen zu 100 % befallen waren.

Patentansprüche

1. Triazolopyrimidine der Formel I

 R_n

- in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben:
 - n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5;
- 15 Halogen, Cyano, Hydroxy, Cyanato (OCN), $C_1-C_8-Alkyl$, R C_2-C_{10} -Alkenyl, C_2-C_{10} -Alkinyl, C_1-C_6 -Halogenalkyl, C2-C10-Halogenalkenyl, C1-C6-Alkoxy, C2-C10-Alkenyloxy, $C_2-C_{10}-Alkinyloxy$, $C_1-C_6-Halogenalkoxy$, $C_3-C_6-Cycloalkyl$, $C_3-C_6-Cycloalkenyl$, $C_3-C_6-Cycloalkoxy$, $C_1-C_8-Alkoxycarbo-Cycloalkenyl$ nyl, C2-C10-Alkenyloxycarbonyl, C2-C10-Alkinyloxycarbonyl, 20 Aminocarbonyl, C_1 - C_8 -Alkylaminocarbonyl, Di- $(C_1$ - C_8 -) alkylaminocarbonyl, C₁-C₈-Alkoximinoalkyl, C₂-C₁₀-Alkenyloximinocarbonyl, C2-C10-Alkinyloximinoalkyl, C1-C8-Alkylcarbonyl, C2-C10-Alkenylcarbonyl, C2-C10-Alkinylcarbonyl, C3-C6-Cycloalkylcarbonyl, oder ein fünf- bis zehnglie-25 driger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S;
- 30 R¹ $C_1-C_{10}-Alkyl$, $C_2-C_{10}-Alkenyl$, $C_2-C_{10}-Alkinyl$, $C_3-C_{12}-Cyclo-alkyl$, $C_3-C_{10}-Cycloalkenyl$, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei R und/oder R¹ partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a substituiert sein können:

40 Ra Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl,
C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, DiC₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy,
C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₈-Alkoximino,
C₂-C₁₀-Alkenyloximino, C₂-C₁₀-Alkinyloximino,
Aryl-C₁-C₈-alkyloximino, C₂-C₁₀-Alkinyl, C₂-C₁₀-Alke-

10

15

20

25

30

35

40

nyloxycarbonyl, C_2 - C_{10} -Alkinyloxycarbonyl, Phenyl, Naphthyl, fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen R^b tragen können:

Rb Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, Mercapto, Amino, Carboxyl, Aminocarbonyl, Aminothiocarbonyl, Alkyl, Haloalkyl, Alkenyl, Alkenyloxy, Alkinyloxy, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Alkylamino, Dialkylamino, Formyl, Alkylcarbonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyl, Alkylsulfonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminocarbonyl, Dialkylaminocarbonyl, Alkylaminothiocarbonyl, Dialkylaminothiocarbonyl, wobei die Alkylgruppen in diesen Resten 1 bis 6 Kohlenstoffatome enthalten und die genannten Alkenyl- oder Alkinylgruppen in diesen Resten 2 bis 8 Kohlenstoffatome enthalten;

und/oder einen bis drei der folgenden Reste:

Cycloalkyl, Cycloalkoxy, Heterocyclyl, Heterocyclyloxy, wobei die cyclischen Systeme 3 bis 10 Ringglieder enthalten; Aryl, Aryloxy, Arylthio, Aryl-C₁-C₆-alkoxy, Aryl-C₁-C₆-alkyl, Hetaryl, Hetaryloxy, Hetarylthio, wobei die Arylreste vorzugsweise 6 bis 10 Ringglieder, die Hetarylreste 5 oder 6 Ringglieder enthalten, wobei die cyclischen Systeme partiell oder vollständig halogeniert oder durch Alkyl- oder Haloalkylgruppen substituiert sein können; und

- R^2 C_1 - C_4 -Alkyl, C_2 - C_4 -Alkenyl oder C_2 - C_4 -Alkinyl, die durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_2 -Alkoxy oder C_1 - C_4 -Alkoxy-carbonyl substituiert sein können.
- 2. Triazolopyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1, in der der Index und die Substituenten folgende Bedeutung haben:
- 45 n 0 oder eine ganze Zahl von 1 bis 5;

49

5

40

- R Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkinyl, C₁-C₆-Halogenalkyl, C₂-C₁₀-Halogenalkenyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₂-C₁₀-Alkenyloxy, C₂-C₁₀-Alkinyloxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkenyl, C₃-C₆-Cycloalkoxy oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, Noder S;
- 10 R¹ C₁-C₁₀-Alkyl, C₂-C₁₀-Alkenyl, C₂-C₁₀-Alkinyl, C₃-C₁₀-Cyclo-alkyl, C₃-C₁₀-Cycloalkenyl, Phenyl, Naphthyl, oder ein fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,

wobei R¹ partiell oder vollständig halogeniert oder durch eine bis vier gleiche oder verschiedene Gruppen R^a substituiert sein kann:

- Ra Halogen, Cyano, Nitro, Hydroxy, C₁-C₆-Alkyl,
 C₁-C₆-Halogenalkyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Halogenalkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylthio, C₁-C₆-Alkylamino, DiC₁-C₆-alkylamino, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkenyloxy,
 C₃-C₆-Alkinyloxy, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl, Naphthyl,
 fünf- bis zehngliedriger gesättigter, partiell ungesättigter oder aromatischer Heterocyclus, enthaltend
 ein bis vier Heteroatome aus der Gruppe O, N oder S,
- wobei diese aliphatischen, alicyclischen oder aromatischen Gruppen ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert sein oder eine bis drei Gruppen Rb tragen können,
 und
- 35 R^2 $C_1-C_4-Alkyl$, das durch Halogen, Cyano, Nitro oder $C_1-C_2-Alkoxy$ substituiert sein kann.
 - 3. Triazolopyrimidine der Formel I gemäß Anspruch 1, in der der Index und die Substituenten die folgenden Bedeutungen haben:
 - n eine ganze Zahl von 1 bis 3;
- R Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkylcarbonyl, C₁-C₆-Alkoximino-C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyloximino-C₁-C₆-alkyl, C₂-C₆-Alkinyloximino-C₁-C₆-alkyl;

- R^1 $C_3-C_8-Alkyl$, $C_3-C_8-Alkenyl$, $C_3-C_8-Alkinyl$, $C_3-C_6-Cycloal-kyl$, $C_5-C_6-Cycloalkenyl$;
- Ra Halogen, Cyano, C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₆-Alkoxy, C₁-C₆-Alkoxycarbonyl, C₁-C₆-Alkoximino, C₂-C₆-Alkenyloximino, C₂-C₆-Alkinyloximno;
 - R^c Halogen, Cyano, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_6 -Alkoxy;

- R^2 $C_1-C_4-Alkyl$, das durch Halogen substituiert sein kann.
- Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß
 Ansprüchen 1 bis 3 durch Umsetzung von 5-Aminotriazol der
 Formel II

20

mit Dicarbonylverbindungen der Formel III.

$$R^2$$
 R_n
 R_n

25

5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I'

wobei n, R und R¹ die in Ansprüchen 1 bis 3 gegebene Bedeutung haben und R^A Wasserstoff oder C₁-C₃-Alkyl, das gemäß Ansprüchen 1 bis 3 substituiert sein kann, bedeutet, durch Umsetzung von Halogenverbindungen der Formel IV

$$\mathbb{R}^2$$
 \mathbb{R}^2 \mathbb{R}^2 \mathbb{R}^2 \mathbb{R}^2 \mathbb{R}^2

40

in der X für Halogen steht, mit substituierten Malonsäureestern der Formel V,

$$R^{X_{0}} \longrightarrow R^{X_{0}} \longrightarrow R^{X_{0}}$$

51

in der R^X für C_1 - C_4 -Alkyl, Allyl, Phenyl oder Benzyl steht, zu Verbindungen der Formel VI

$$R^1$$
 R_n
 R^2
 $COOR^X$
 R^3
 $COOR^X$

anschließender Verseifung von VI zu der Säure VIa und Decar-10 boxilierung von VIa

$$R^1$$
 R^1
 R^2
 R^3
 R^4
 Dicarbonylverbindungen der Formel III gemäß Anspruch 4, in denen n eine ganze Zahl von 1 bis 5 ist und R¹ und R² nicht beide Methyl bedeuten.

7. Zur Bekämpfung von Schadpilzen geeignetes Mittel, enthaltend einen festen oder flüssigen Trägerstoff und eine Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1.

25

15

5

8. Verwendung der Verbindungen I gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines zur Bekämpfung von Schadpilzen geeigneten Mittels.

9. Verfahren zur Bekämpfung von Schadpilzen, dadurch gekenn20 zeichnet, daß man die Pilze oder die vor Pilzbefall zu schützenden Materialien, Pflanzen, den Boden oder Saatgüter mit
einer wirksamen Menge einer Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.

35

This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning Operations and is not part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

BLACK BORDERS

IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES

FADED TEXT OR DRAWING

BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING

SKEWED/SLANTED IMAGES

COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS

GRAY SCALE DOCUMENTS

LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT

REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

OTHER:

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.